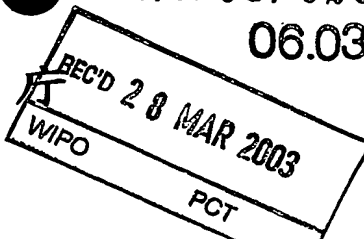


日 本 国 特 許
JAPAN PATENT OFFICE

PCT/JP03/02632

06.03.03



別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office

出 願 年 月 日

Date of Application:

2002年 3月 7日

出 願 番 号

Application Number:

特願2002-061835

[ST.10/C]:

[JP2002-061835]

出 願 人

Applicant(s):

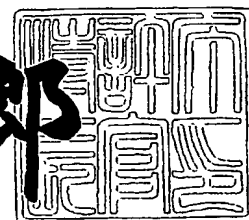
株式会社エス・ディー・エス バイオテック

PRIORITY DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH
RULE 17.1(a) OR (b)

2003年 1月28日

特 許 庁 長 官
Commissioner,
Japan Patent Office

太田信一郎



BEST AVAILABLE COPY 出証番号 出証特2003-3002213

【書類名】 特許願

【整理番号】 BOP4027

【提出日】 平成14年 3月 7日

【あて先】 特許庁長官 及川 耕造 殿

【国際特許分類】 C07C233/00
C07D261/06
A01N 43/80

【発明者】

【住所又は居所】 茨城県つくば市緑ヶ原2丁目1番 株式会社エス・ディー・エス バイオテック つくば研究所内

【氏名】 下園 典子

【発明者】

【住所又は居所】 茨城県つくば市緑ヶ原2丁目1番 株式会社エス・ディー・エス バイオテック つくば研究所内

【氏名】 和田 浩

【特許出願人】

【識別番号】 000127879

【住所又は居所】 東京都港区芝2丁目5番6号

【氏名又は名称】 株式会社エス・ディー・エス バイオテック

【代理人】

【識別番号】 100081086

【住所又は居所】 東京都中央区日本橋人形町2丁目2番6号 堀口第2ビル7階 大家特許事務所

【弁理士】

【氏名又は名称】 大家 邦久

【電話番号】 03(3669)7714

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 043731

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9712845

【プルーフの要否】 要

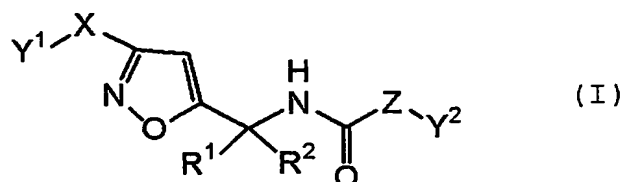
【書類名】 明細書

【発明の名称】 置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体及び農園芸用殺菌剤

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式 (I)

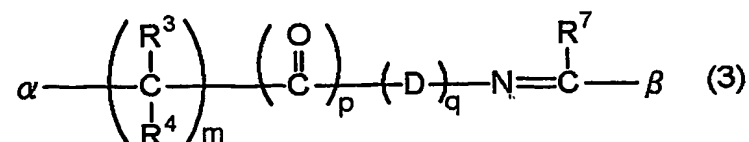
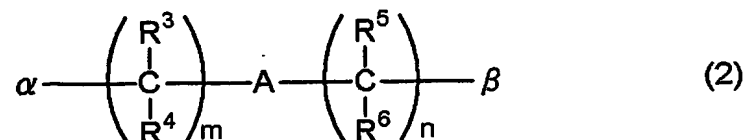
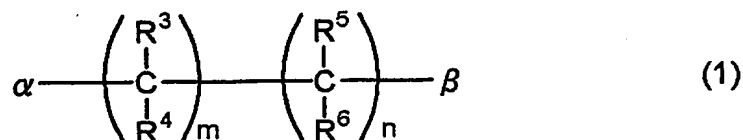
【化1】



〔式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Xは次式 (1)、(2) または (3)

【化2】

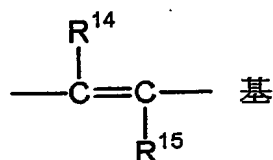


(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカ

ルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}-$ 基（基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基または

【化3】



（基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。）

を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3までの整数を表わし、

p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

R^7 は、水素原子もしくは低級アルキル基を表わし、

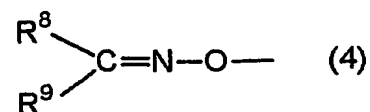
Dは酸素原子または $-NH-$ 基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）

で示される基を表わし、

Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリアル基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式（4）

【化4】



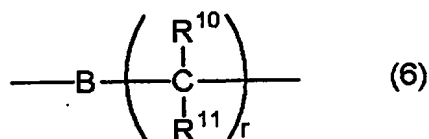
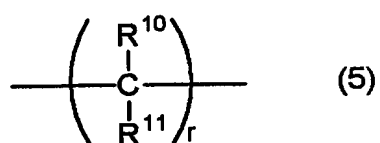
（式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基

、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、

Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

Zは、次式(5)または(6)

【化5】



(式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

Bは酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基(式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わす。)で示される基を表わす。

ただし、以下の(1)～(3)を除く：

(1) Xが単結合(式(1)において m 及び n が0の場合)であり、 Y^1 が4-ヒドロキシ-3, 5-ジ-tert-ブチルフェニル基を表わす化合物、

(2) (2-1) Zが単結合(式(5)において r が0の場合)であるとき、もしくは(2-2) ZがNH基(式(6)において $r=0$ でBが $-NH-$ 基を表わす場合)のとき、 R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、Xが単結合(式(1)において m 及び n が0の場合)であり、 Y^1 及び Y^2 が共に無置換のフェニル基を表わす化合物

(3) R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、Zが単結合(式(5)においてrが0の場合)を表わし、 Y^2 が置換されていてもよい4-ヒドロキシシンノリン-3-イル基を表わす化合物。]

で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項2】 請求項1に記載の一般式(I)において、 R^1 及び R^2 が互いに独立して、それぞれ水素原子、または置換されていてもよい低級アルキル基を表わす請求項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項3】 請求項1に記載の一般式(I)において、Zが酸素原子であり(式(6)においてrが0でBが酸素原子の場合)、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項4】 請求項1に記載の一般式(I)において、Zが $-NR^{13}$ -基(基中、 R^{13} は、水素原子または低級アルキル基を表わす。)(式(6)においてrが0でBが $-NR^{13}$ -基の場合)を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項5】 請求項1に記載の一般式(I)において、X及びZが単結合(式(1)においてm及びnが0であり、式(5)においてrが0の場合)であり、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項6】 請求項1に記載の一般式(I)において、Xが式(1)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、m+nが1、2または3である請求

項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

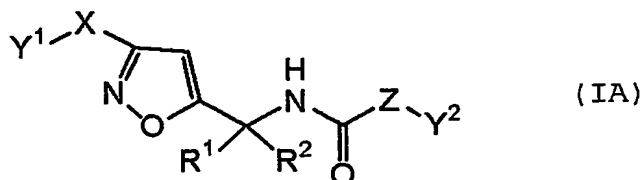
【請求項 7】 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X が式 (2) で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、n が 1 または 2 であり、 $m+n$ が 1、2 または 3 である請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項 8】 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X が式 (2) で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、n が 0 であり、m が 0、1 または 2 である請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項 9】 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X が式 (3) で示される基を表わし、基中の R^3 及び R^4 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 $m=0$ 、1 または 2 を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【請求項 10】 一般式 (IA)

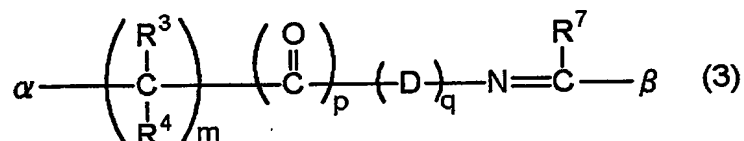
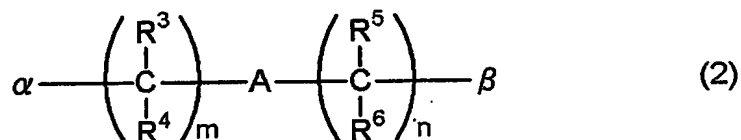
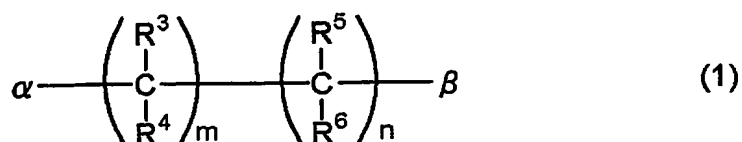
【化 6】



[式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Xは次式(1)、(2)または(3)

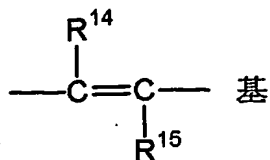
【化7】



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}-$ 基(基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C \equiv C-$ 基または

【化 8】



(基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。)
を表わし、

m 及び n はそれぞれ0または1～3までの整数を表わし、

p 及び q はそれぞれ0または1を表わし、

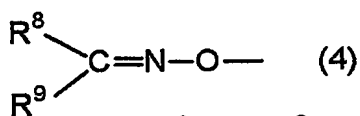
R^7 は、水素原子もしくは低級アルキル基を表わし、

D は酸素原子または ---NH--- 基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。
で示される基を表わし、

Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式(4)

【化 9】

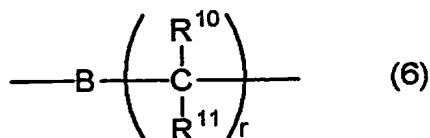
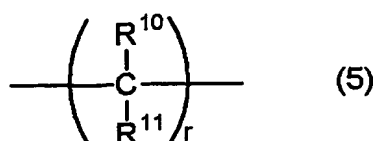


(式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、

Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

Zは、次式(5)または(6)

【化10】



(式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

Bは酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基(式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わす。)で示される基を表わす。]

で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

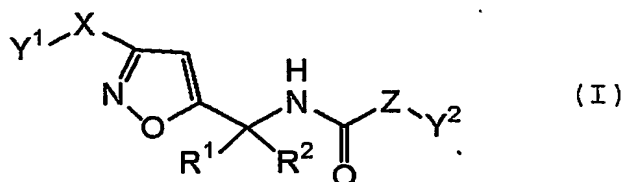
【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、

1) 一般式(I)

【化11】

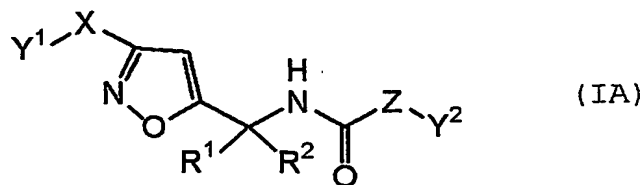


(式中の記号は後記の通り。)

で示される新規な置換イソキサゾール誘導体及び

2) 一般式(IA)

【化 1 2】



(式中の記号は後記の通り。)

で示される置換イソキサゾール誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

【0 0 0 2】

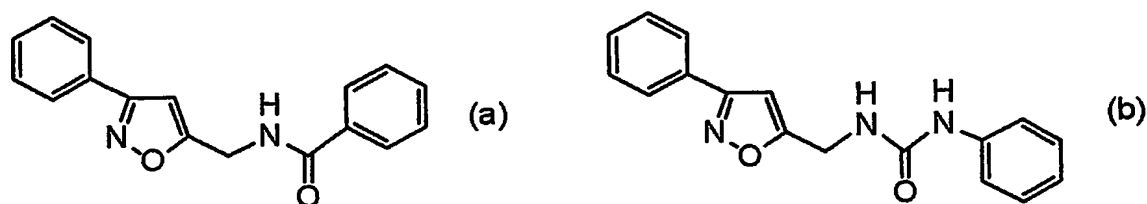
【従来の技術】

1) 特表平 9 - 5 0 9 9 5 1 号公報、国際公開第 9 8 2 8 2 8 2 号、米国特許第 5 8 5 9 2 5 7 号明細書、英国特許第 1 0 6 7 2 0 3 号および欧州特許第 2 7 7 7 9 1 号公報には置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体の化合物が開示されているが、殺菌活性についての記載はない。

【0 0 0 3】

2) J. C. S. Perkin Trans. I, 16, 1694-1696 (1976) には、下記化号物 (a) および (b) を出発原料としたスピロオキサゾリン環形成反応を行っているが、化合物 (a) および (b) の殺菌活性についての記載はない。

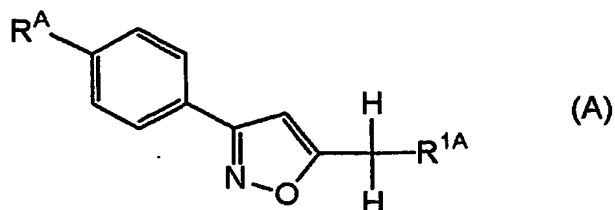
【化 1 3】



【0 0 0 4】

3) 特開昭 5 2 - 1 5 4 5 2 5 公報には、下記一般式 (A)

【化 1 4】



(式中、 R^A はクロル基、ブロム基、フルオロ基、トリフルオロメチル基または水素原子を表わし、 R^{1A} はブロム基、クロル基、イソチオシアナート基、アミノ基、アミノ・塩酸塩もしくは・臭化水素塩、 $-NHCSNH$ (C1～C3) アルキル、 $-NHCOO$ (C1～C3) アルキルまたは3, 5, 7-トリアザー1-アゾニアアダマンチルクロリドもしくはブロミドを表わす。)が、殺菌剤として、特にトマト疫病、マメうどんこ病、キュウリ炭疽病、イネいもち病、コムギ斑点病、ブドウ灰色かび病、リンゴ黒星病、ブドウべと病、テンサイ褐斑病に対して防除活性を示すことが示されている。しかし、この公報明細書に記載された化合物の殺菌剤としての活性は充分ではない。

【0 0 0 5】

【発明が解決しようとする課題】

農作物あるいは園芸作物の栽培においては、生産効率に重大な影響を与える様々な病害が知られており、例えば、稲作におけるいもち病及び紋枯病、果樹、野菜及び穀類栽培におけるうどんこ病、べと病、及び灰色かび病などを重要病害として挙げることができる。

【0 0 0 6】

これら植物病原菌によって引き起こされる病害に関し、これまで各種殺菌剤が使用されてきている。しかしながら、従来使用された公知薬剤は、長年の使用によって耐性菌が発生し、十分な殺菌効果を得られず使用できなくなったり、十分な殺菌効果を得るために他の薬剤と組み合わせて用いる必要があった。従って、農作物あるいは園芸作物の栽培分野では、従来の薬剤とは化学構造の骨格が異なり、かつ十分な防除効果を発揮する新規な植物病害防除性化合物の出現が要望されている。本発明は、上述したような従来技術に伴う問題点を解決しようとするものである。本発明の目的は、従来の薬剤とは化学構造の骨格が異なるために既

知の薬剤耐性菌に交差することなく、かつ十分な植物病害防除活性を発揮する新規な薬剤を提供することにある。

【0007】

【課題を解決するための手段】

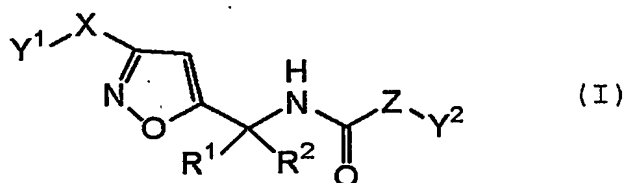
本発明者らは、上記の目的を達成するために、これまで植物病害防除活性の知られていない新規の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を合成しその植物病害防除活性と有用性について鋭意検討した。その結果、後記の一般式（I）または一般式（IA）で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体が植物に薬害を与えることなく優れた植物病原菌防除効果を有することを見出した。

【0008】

すなわち、本発明は下記一般式（I）で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体および下記一般式（IA）で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を活性成分として含有することを特徴とする農園芸用病害防剤に関する。

【0009】

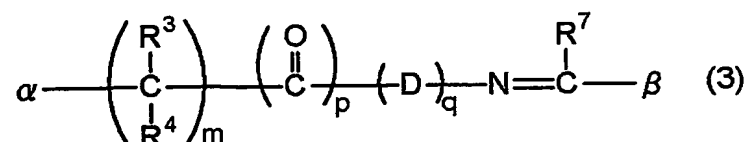
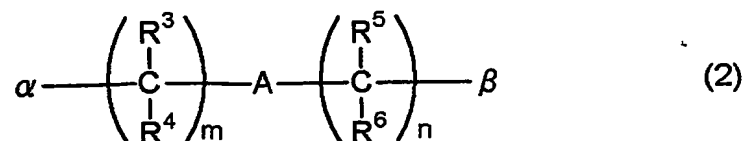
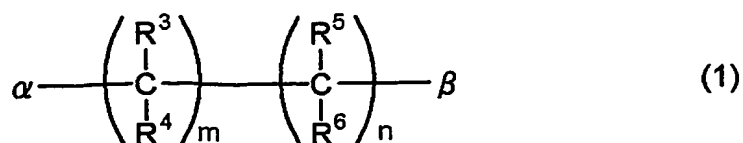
【化15】



式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Xは次式（1）、（2）または（3）

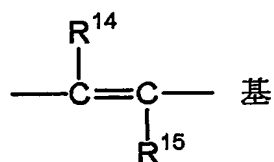
【化 16】



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}-$ 基(基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基または

【化 17】



(基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。)
を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3までの整数を表わし、

p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

R^7 は、水素原子もしくは低級アルキル基を表わし、

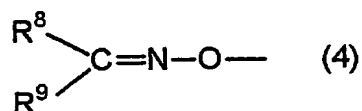
Dは酸素原子または-NH-基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）

で示される基を表わし、

Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式（4）

【化18】

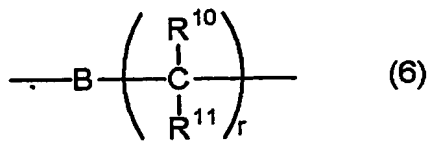
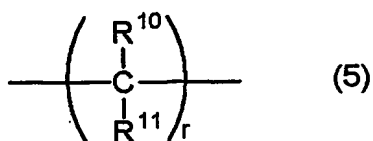


（式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。）を表わし、

Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

Zは、次式（5）または（6）

【化19】



（式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基または

シアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は 0 または 1～3 の整数を表わし、

B は酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基（式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わす。）で示される基を表わす。

ただし、以下の（１）～（３）を除く：

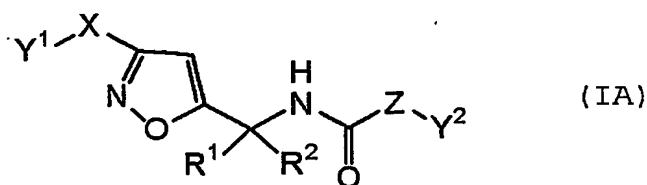
（１） X が単結合（式（１）において m 及び n が 0 の場合）であり、 Y^1 が 4-ヒドロキシ-3, 5-ジ-tert-ブチルフェニル基を表わす化合物、

（２）（2-1） Z が単結合（式（５）において r が 0 の場合）であるとき、もしくは（2-2） Z が NH 基（式（６）において $r=0$ で B が $-NH-$ 基を表わす場合）のとき、 R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、 X が単結合（式（１）において m 及び n が 0 の場合）であり、 Y^1 及び Y^2 が共に無置換のフェニル基を表わす化合物

（３） R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、 Z が単結合（式（５）において r が 0 の場合）を表わし、 Y^2 が置換されていてもよい 4-ヒドロキシシンノリン-3-イル基を表わす化合物。

【0010】

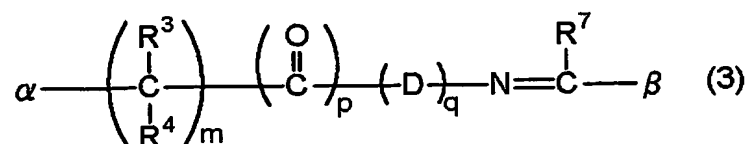
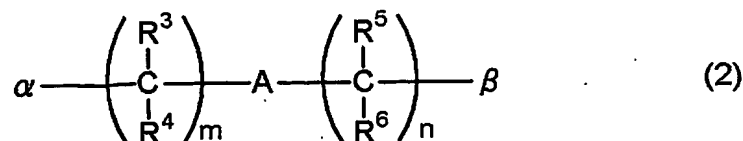
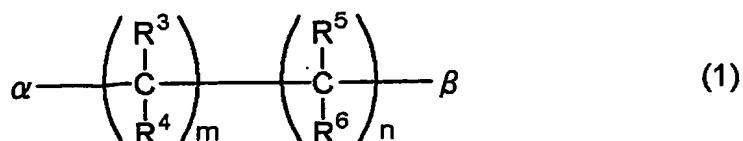
【化20】



式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

X は次式（１）、（２）または（３）

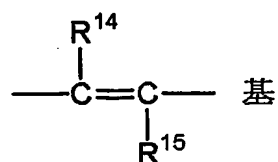
【化 2 1】



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}-$ 基(基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基または

【化 2 2】



(基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。)
を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3までの整数を表わし、

p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

R^7 は、水素原子もしくは低級アルキル基を表わし、

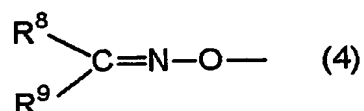
Dは酸素原子または-NH-基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）

で示される基を表わし、

Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式（4）

【化23】

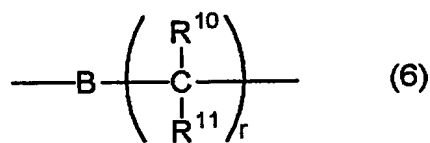
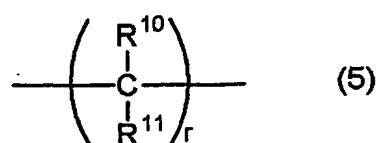


（式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。）を表わし、

Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

Zは、次式（5）または（6）

【化24】



（式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基または

シアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

B は酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基（式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わす。）で示される基を表わす。

【0011】

【本発明化合物】

一般式（I）または（IA）中、低級アルキル基とは、炭素数1～6のアルキル基であり、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシルまたはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルケニル基とは、二重結合を1～3個有する炭素数2～6のアルケニル基であり、ビニル、プロペニル、ブテニル、ブタンジエニル、ヘキサントリエニル、またはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルキニル基とは、三重結合を1～3個有する炭素数2～6のアルキニル基であり、例えばエチニル、プロピニル、ペンチニル、ヘキシニルまたはそれらの異性体基が挙げられる。

【0012】

シクロアルキル基とは、炭素数3～8のシクロアルキル基であり、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基が挙げられる。

シクロアルケニル基とは、炭素数3～8のシクロアルケニル基であり、例えばシクロプロピニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニルまたはそれらの異性体基が挙げられる。

【0013】

低級アルコキシ基とは、炭素数1～6のアルコキシ基であり、メチルオキシ基、エチルオキシ基、プロピルオキシ基、ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基またはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルコキシカルボニル基とは、炭素数1～6のアルコキシカルボニル基であり、メチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニル基、プロピルオキシ

カルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ヘキシルオキシカルボニル基またはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルキルチオ基とは、炭素数1～6のアルキルチオ基であり、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基またはそれらの異性体基が挙げられる。

ハロゲン原子とは、フッ素、塩素、臭素、またはヨウ素原子である。

【0014】

ヘテロアリール基とは、環形成原子として酸素原子、硫黄原子、窒素原子等のヘテロ原子を1～3個有する芳香族性を示す単環または二環式のヘテロ環であり、例えばピロール、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、フラン、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、イソキサゾール、イソチアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾオキサゾール、インダゾール、インドール、キノリン、プリン、プテリジン環等が挙げられる。

【0015】

脂肪族ヘテロ環は、環形成原子として酸素原子、硫黄原子、窒素原子等のヘテロ原子を1～3個有する5～6員環の脂肪族ヘテロ環であり、例えばピロリジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、テトラヒドロピラン環、テトラヒドロフラン環、モルホリン環、ジオキサン等が挙げられる。

【0016】

置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環は、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、置換されていてもよいフェニル基、低級アシル基、低級アシルオキシ基から選ばれる1または2以上の置換基で置換されていてもよい。

【0017】

置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニルオキシ基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基は、

置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカンスルフィニル基、低級アルカンスルホニル基、 $R^{16}-NHC$
 $O-$ 基、 $R^{16}-CONH-$ 基（基中、 R^{16} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、 $R^{17}O-NHCO-$ 基（基中、 R^{17} は低級アルキル基を表わす。）、
 $R^{18}-CO-$ 基（基中、 R^{18} はハロゲン原子等で置換されていてもよい炭化水素基（例えば低級アルキル基、フェニル基等）を表わす。）、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、置換されていてもよいシクロアルキル基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、 $R^{19}O-N=C(R^{20})-$
 基（基中、 R^{19} は水素原子または低級アルキル基を表わし、 R^{20} は水素原子、低級アルキル基またはアミノ基を表わす。）、脂肪族ヘテロシクロ環基、低級アルキルカルボニルヒドラジノ基、低級アルキルオキシカルボニルヒドラジノ基、ホルミル基、 $H_2NN=C(R^{21})-$ 基、 $R^{22}(O)CHNN=C(R^{21})-$ 基（基中、 R^{21} および R^{22} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、水酸基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニルオキシ基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、ハロゲン原子、シアノ基、及びニトロ基から選ばれる1または2以上の置換基で置換されていてもよく、また隣り合う置換基が一緒になって置換されていてもよい環状アルキル基や置換されていてもよい環状エーテル基を形成してもよい。

【0018】

本発明の一般式（I）または（IA）の化合物として、好ましくは以下に示すものが挙げられる。

〔1〕 R^1 及び R^2 が互いに独立して、それぞれ水素原子、または置換されていてもよい低級アルキル基を表わす置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

〔2〕Zが酸素原子であり（式（6）においてrが0でBが酸素原子の場合）、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

〔3〕Zが $-NR^{13}-$ 基（基中、 R^{13} は、水素原子または低級アルキル基を表わ

す。) (式(6)において r が0で B が $-NR^{13}$ -基の場合)を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[4] X 及び Z が単結合(式(1)において m 及び n が0であり、式(5)において r が0の場合)であり、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[5] X が式(1)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 $m+n$ が1、2または3である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[6] X が式(2)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が1または2であり、 $m+n$ が1、2または3である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[7] X が式(2)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が0であり、 m が0、1または2である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[8] X が式(3)で示される基を表わし、基中の R^3 及び R^4 が同一でも異なっ

てもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 $m = 0, 1$ または 2 を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

【 0 0 1 9 】

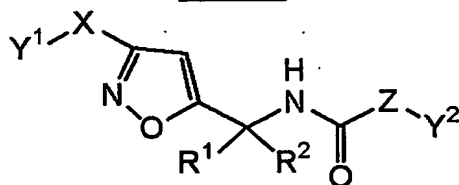
次に一般式 (I) で示される本発明化合物の代表例を表 1 - 1 ~ 表 4 - 5 (表 1 ~ 表 2 7) に示すが、本発明化合物はこれらに限定されるものではない (化合物番号は明細書を通じて同一の番号を使用する。)

表中、Me はメチル基を表し、Et はエチル基を表わし、i - Pr はイソプロピル基を表わし、t - Bu はターシャリーブチル基を表わし、Ac はアセチル基を表わし、Ph はフェニル基を表わす。

【0020】

【表1】

表1-1

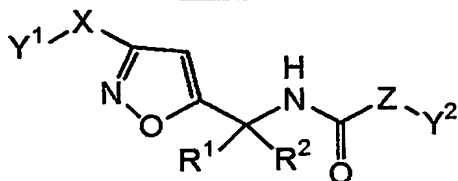


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-1	Me-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-2	Et-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-3	n-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-4	i-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-5	c-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-6	c-Hex-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-7	n-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-8	i-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-9	t-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-10	Me₂C=CH-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-11	I-C≡C-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-12	c-Pen-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-13		—	H	H	O	C₆H₅-
I-14		—	H	H	O	C₆H₅-
I-15		—	H	H	O	C₆H₅-
I-16		—	H	H	O	C₆H₅-
I-17		—	H	H	O	C₆H₅-

【0021】

【表2】

表 1-2

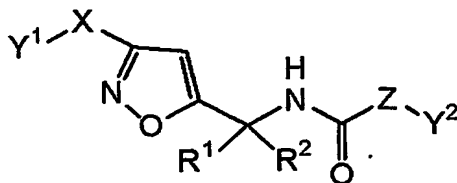


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-18		—	H	H	O	C₆H₅-
I-19		—	H	H	O	C₆H₅-
I-20		—	H	H	O	C₆H₅-
I-21		—	H	H	O	C₆H₅-
I-22		—	H	H	O	C₆H₅-
I-23		—	H	H	O	C₆H₅-
I-24	4-Me-3-F-C₆H₃-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-25	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-26	4-MeO-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-27	4-F-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-28	2-Cl-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-29	3-Cl-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-30	4-Cl-C₆H₄-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-31	2-pyridyl-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-32	2-thienyl-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-33	2-furyl-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-34	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	O	2-MeO-C₆H₄-

【0022】

【表3】

表 1-3

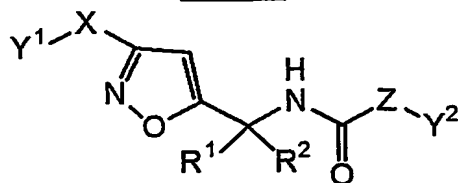


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-35	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	O	2-Me-C₆H₄-
I-36	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	O	2-HOOC-C₆H₄-
I-37	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	O	2-MeOOC-C₆H₄-
I-38`	C₆H₅-	-CH₂-	H	H	O	C₆H₅-
I-39	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	O	C₆H₅-
I-40	C₆H₅-	-O-CH₂-	H	H	O	C₆H₅-
I-41	C₆H₅-	—	H	H	-O-CH₂-	C₆H₅-
I-42	C₆H₅-	—	H	H	-O-CH₂-	HC≡C—
I-43	C₆H₅-	—	H	H	-O-CH₂-	I-C≡C—
I-44	C₆H₅-	—	H	H	-O-CH₂-	H₂C≡C—
I-45	C₆H₅-	—	H	H		C₆H₅-
I-46	C₆H₅-	—	H	H		C₆H₅-
I-47	i-Pr-	—	H	H		C₆H₅-
I-48	C₆H₅-	—	H	H	-CH₂-	C₆H₅-
I-49	C₆H₅-	—	H	H		C₆H₅-
I-50	C₆H₅-	—	H	H		c-Pr-

【0023】

【表4】

表1-4

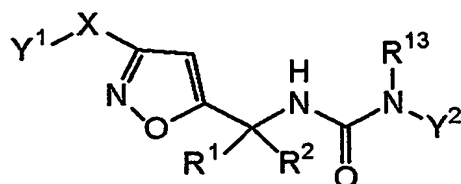


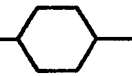
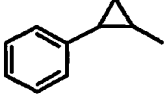

化合物 番号	Y ¹	X	R ¹	R ²	Z	Y ²
I-52	C ₆ H ₅ -		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-53		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-54		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-55		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-56	i-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-57	t-Bu-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-58	c-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-59	i-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-60	t-Bu-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-61	c-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -

【0024】

【表 5】

表 2-1

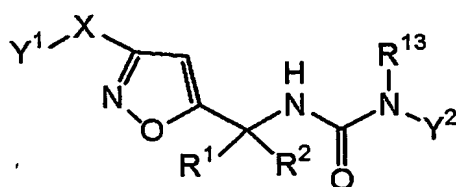


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-1	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-2	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	C₆H₅-
II-3	i-Pr-	—	H	H	H	C₆H₅-
II-4	i-Pr-	—	H	H	Me	C₆H₅-
II-5	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Pr-
II-6	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Pen-
II-7	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Hex-
II-8	4-MeO-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Hex-
II-9	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Hex-
II-10	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Pen-
II-11	C₆H₅-	—	H	H	H	H₃C- 
II-12	C₆H₅-	—	H	H	Me	C₆H₆-
II-13	C₆H₅-	-CH₂-	H	H	H	c-Hex-
II-14	C₆H₅-	-CH₂-	H	H	H	c-Pen-
II-15	i-Pr-	—	H	H	H	c-Hex-
II-16	C₆H₅-	—	H	H	H	
II-17	C₆H₅-	—	H	H	H	 COOMe
II-18	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	H	H	c-Hex-
II-19	4-Me-C₆H₄-	—	Et-	H	H	c-Hex-

【0025】

【表6】

表 2-2

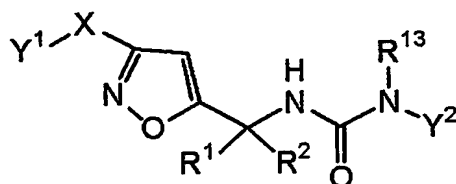


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-20	4-Me-C₆H₄-	—	c-Pr-	H	H	c-Hex-
II-21	4-Me-C₆H₄-	—	I-Pr-	H	H	c-Hex-
II-22	4-Me-C₆H₄-	—	MeO-	H	H	c-Hex-
II-23	4-Me-C₆H₄-	—	MeOOC-	H	H	c-Hex-
II-24	4-Me-C₆H₄-	—	NC-	H	H	c-Hex-
II-25	4-Me-C₆H₄-	—	Cl-	H	H	c-Hex-
II-26	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	Me-	H	c-Hex-
II-27	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	MeO-	H	c-Hex-
II-28	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	MeOOC-	H	c-Hex-
II-29	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	NC-	H	c-Hex-
II-30	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	Cl-	H	c-Hex-
II-31	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Me-C₆H₄-
II-32	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Me-C₆H₄-
II-33	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-34	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-Bu-C₆H₄-
II-35	C₆H₅-	—	H	H	H	2-MeO-C₆H₄-
II-36	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeO-C₆H₄-
II-37	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-C₆H₄-
II-38	C₆H₅-	—	H	H	H	4-EtO-C₆H₄-
II-39	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-BuO-C₆H₄-
II-40	C₆H₅-	—	H	H	H	3-t-BuO-C₆H₄-
II-41	C₆H₅-	—	H	H	H	4-i-PrO-C₆H₄-

【0026】

【表7】

表 2-3

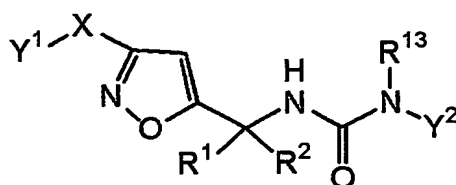


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-42	C₆H₅-	—	H	H	H	4-PhO-C₆H₄-
II-43	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeS-C₆H₄-
II-44	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO₂S-C₆H₄-
II-45	C₆H₅-	—	H	H	H	2-F-C₆H₄-
II-46	C₆H₅-	—	H	H	H	3-F-C₆H₄-
II-47	C₆H₅-	—	H	H	H	4-F-C₆H₄-
II-48	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Cl-C₆H₄-
II-49	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Cl-C₆H₄-
II-50	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Cl-C₆H₄-
II-51	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Br-C₆H₄-
II-52	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Br-C₆H₄-
II-53	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Br-C₆H₄-
II-54	C₆H₅-	—	H	H	H	2-CF₃-C₆H₄-
II-55	C₆H₅-	—	H	H	H	3-CF₃-C₆H₄-
II-56	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃-C₆H₄-
II-57	C₆H₅-	—	H	H	H	2-NC-C₆H₄-
II-58	C₆H₅-	—	H	H	H	3-NC-C₆H₄-
II-59	C₆H₅-	—	H	H	H	4-NC-C₆H₄-
II-60	C₆H₅-	—	H	H	H	2-HO-C₆H₄-
II-61	C₆H₅-	—	H	H	H	3-HO-C₆H₄-
II-62	C₆H₅-	—	H	H	H	4-HO-C₆H₄-
II-63	C₆H₅-	—	H	H	H	4-NO₂-C₆H₄-

【0027】

【表 8】

表 2-4

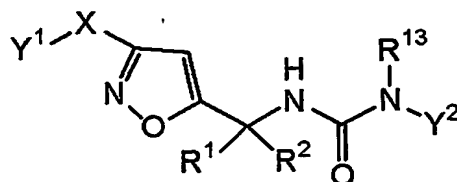


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-64	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃S-C₆H₄-
II-65	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃O-C₆H₄-
II-66	C₆H₅-	—	H	H	H	4-F₂HC-O-C₆H₄-
II-67	C₆H₅-	—	H	H	H	4-HOOC-C₆H₄-
II-68	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOOC-C₆H₄-
II-69	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeHNOC-C₆H₄-
II-70	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeHNOC-C₆H₄-
II-71	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeOCHN-C₆H₄-
II-72	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOCHN-C₆H₄-
II-73	C₆H₅-	—	H	H	H	3-H₂N-C₆H₄-
II-74	C₆H₅-	—	H	H	H	4-H₂N-C₆H₄-
II-75	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Me₂N-C₆H₄-
II-76	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me₂N-C₆H₄-
II-77	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Ph-C₆H₄-
II-78	C₆H₅-	—	H	H	H	2,5-(Cl)₂-C₆H₃-
II-79	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4,(F)₂-C₆H₃-
II-80	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4-(Me)₂-C₆H₃-
II-81	C₆H₅-	—	H	H	H	2,5-(Me)₂-C₆H₃-
II-82	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4-(MeO)₂-C₆H₃-
II-83	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Cl-4-MeO-C₆H₃-
II-84	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-2-HO-C₆H₃-
II-85	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-2-HO-C₆H₃-

【0028】

【表9】

表 2-5

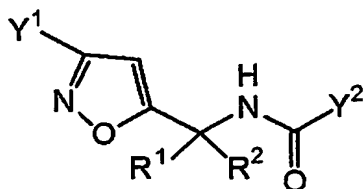


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-86	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-3-F-C₆H₃-
II-87	C₆H₅-	—	H	H	H	3-F-4-MeO-C₆H₃-
II-88	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-F-C₆H₃-
II-89	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-Cl-C₆H₃-
II-90	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-CF₃-C₆H₃-
II-91	C₆H₅-	—	H	H	H	4-ClCH₂-C₆H₃-
II-92	C₆H₅-	—	H	H	H	4-OHC-C₆H₄-
II-93	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOOCHNHN-C₆H₄-
II-94	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CN-3-F-C₆H₃-
II-95	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-96	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-C₆H₄-
II-97	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃O-C₆H₄-
II-98	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-Bu-C₆H₄-
II-99	C₆H₅-	—	H	H	H	2-pyridyl-
II-100	C₆H₅-	—	H	H	H	3-pyridyl-
II-101	C₆H₅-	—	H	H	H	4-pyridyl-
II-102	C₆H₅-	—	H	H	H	2-thienyl-
II-103	C₆H₅-	—	H	H	H	2-furyl-

【0029】

【表10】

表 3-1

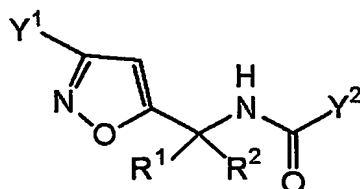


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-1	Me-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-2	ClCH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-3	ClCH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-4	i-Pr-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-5	i-Pr-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-6	c-Hex-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-7	2-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
III-8	2-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-9	3-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-10	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-11	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-12	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-13	4-Et-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-14	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-15	2-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-16	3-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-17	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-18	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-19	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-20	4-EtO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-21	4-t-BuO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-22	3-t-BuO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-23	4-i-PrO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-24	4-PhO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -

【0030】

【表11】

表 3-2

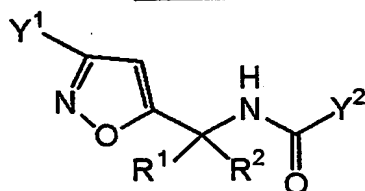


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-25	4-MeS-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-26	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-27	4-MeOS-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-28	4-MeS-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-29	2-F-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-30	3-F-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-31	4-F-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-32	2-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-33	3-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-34	4-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-35	2-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-36	3-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-37	4-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-38	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-39	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-40	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-41	2-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-42	3-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-43	4-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-44	2-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-45	3-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-46	4-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-47	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-48	4-CF ₃ S-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -

【0031】

【表12】

表 3-3

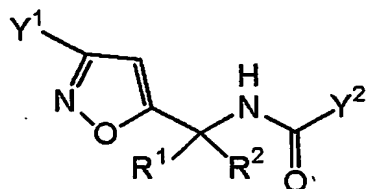


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-49	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-50	4-H ₂ FCO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-51	4-HOOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-52	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-53	3-MeHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-54	4-MeHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-55	4-MeOHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-56	3-MeOCHN-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-57	4-MeOCHN-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-58	3-H ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-59	4-H ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-60	3-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-61	4-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-62	4-Ph-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-63	2,5-(Cl) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-64	3,4,(F) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-65	2,4,-(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-66	2,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-67	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-68	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-69	3-Cl-4-MeO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-70	4-MeO-2-HO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-71	4-Me-2-HO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-72	4-MeO-3-F-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -

【0032】

【表13】

表 3-4

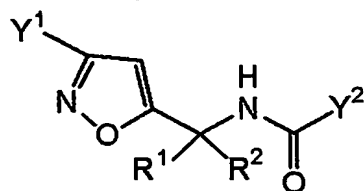


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-73	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-74	4-MeO-2-F-C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-75	3-F-4-MeO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-76	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-77	4-Me-3-Cl-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-78	4-Me-3-CF ₃ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-79	4-ClCH ₂ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-80	4-OHC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-81	4-MeOOCHNHN-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-82	4-CN-3-F-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-83	2-pyridyl-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-84	3-pyridyl-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-85	4-pyridyl-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-86	2-thienyl-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-87	2-furyl-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-88		H	H	C ₆ H ₅ -
III-89		H	H	C ₆ H ₅ -
III-90		H	H	C ₆ H ₅ -
III-91		H	H	C ₆ H ₅ -

【0033】

【表14】

表 3-5

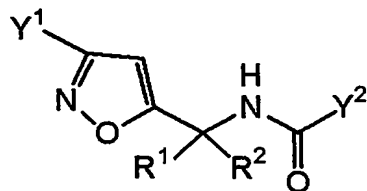


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-92		H	H	C₆H₅-
III-93		H	H	C₆H₅-
III-94		H	H	C₆H₅-
III-95		H	H	C₆H₅-
III-96		H	H	C₆H₅-
III-97		H	H	C₆H₅-
III-98		H	H	C₆H₅-
III-99		H	H	C₆H₅-

【0034】

【表15】

表 3-6

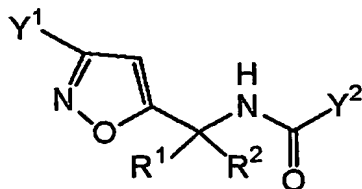


化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-100		H	H	C ₆ H ₅ -
III-101		H	H	C ₆ H ₅ -
III-102		H	H	C ₆ H ₅ -
III-103		H	H	C ₆ H ₅ -
III-104		H	H	C ₆ H ₅ -
III-105	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Me-C ₆ H ₄ -
III-106	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Me-C ₆ H ₄ -
III-107	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-108	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -
III-109	C ₆ H ₅ -	H	H	2-MeO-C ₆ H ₄ -
III-110	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeO-C ₆ H ₄ -
III-111	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-112	C ₆ H ₅ -	H	H	4-EtO-C ₆ H ₄ -

【0035】

【表16】

表 3-7

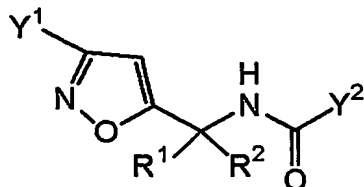


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-113	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-BuO-C ₆ H ₄ -
III-114	C ₆ H ₅ -	H	H	3-t-BuO-C ₆ H ₄ -
III-115	C ₆ H ₅ -	H	H	4-i-PrO-C ₆ H ₄ -
III-116	C ₆ H ₅ -	H	H	4-PhO-C ₆ H ₄ -
III-117	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeS-C ₆ H ₄ -
III-118	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -
III-119	C ₆ H ₅ -	H	H	2-F-C ₆ H ₄ -
III-120	C ₆ H ₅ -	H	H	3-F-C ₆ H ₄ -
III-121	C ₆ H ₅ -	H	H	4-F-C ₆ H ₄ -
III-122	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -
III-123	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Cl-C ₆ H ₄ -
III-124	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-125	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Br-C ₆ H ₄ -
III-126	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Br-C ₆ H ₄ -
III-127	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Br-C ₆ H ₄ -
III-128	C ₆ H ₅ -	H	H	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-129	C ₆ H ₅ -	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-130	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-131	C ₆ H ₅ -	H	H	2-NC-C ₆ H ₄ -
III-132	C ₆ H ₅ -	H	H	3-NC-C ₆ H ₄ -
III-133	C ₆ H ₅ -	H	H	4-NC-C ₆ H ₄ -
III-134	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
III-135	C ₆ H ₅ -	H	H	3-HO-C ₆ H ₄ -
III-136	C ₆ H ₅ -	H	H	4-HO-C ₆ H ₄ -

【0036】

【表17】

表 3-8

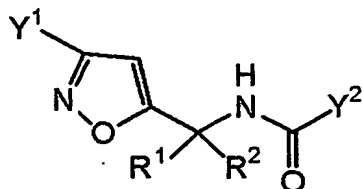


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-137	C ₆ H ₅ -	H	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -
III-138	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ S-C ₆ H ₄ -
III-139	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
III-140	C ₆ H ₅ -	H	H	4-F ₂ HC-O-C ₆ H ₄ -
III-141	C ₆ H ₅ -	H	H	4-HOOC-C ₆ H ₄ -
III-142	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -
III-143	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeHNOC-C ₆ H ₄ -
III-144	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeHNOC-C ₆ H ₄ -
III-145	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeOCHN-C ₆ H ₄ -
III-146	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOCHN-C ₆ H ₄ -
III-147	C ₆ H ₅ -	H	H	3-H ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-148	C ₆ H ₅ -	H	H	4-H ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-149	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-150	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-151	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Ph-C ₆ H ₄ -
III-152	C ₆ H ₅ -	H	H	2,5-(Cl) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-153	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4,(F) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-154	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4, -(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-155	C ₆ H ₅ -	H	H	2,5-(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-156	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-157	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Cl-4-MeO-C ₆ H ₃ -
III-158	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-2-HO-C ₆ H ₃ -
III-159	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-2-HO-C ₆ H ₃ -
III-160	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-3-F-C ₆ H ₃ -

【0037】

【表18】

表 3-9

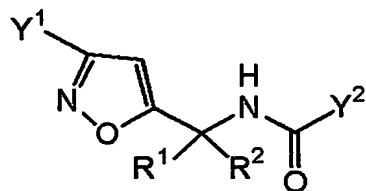


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-161	C ₆ H ₅ -	H	H	3-F-4-MeO-C ₆ H ₃ -
III-162	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -
III-163	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-3-Cl-C ₆ H ₃ -
III-164	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-3-CF ₃ -C ₆ H ₃ -
III-165	C ₆ H ₅ -	H	H	4-ClCH ₂ -C ₆ H ₄ -
III-166	C ₆ H ₅ -	H	H	4-OHC-C ₆ H ₄ -
III-167	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOOCHNHN-C ₆ H ₄ -
III-168	C ₆ H ₅ -	H	H	2-HO-3-OHCHN-C ₆ H ₃ -
III-169	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CN-3-F-C ₆ H ₃ -
III-170	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-171	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-172	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
III-173	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -
III-174	C ₆ H ₅ -	H	H	2-pyridyl-
III-175	C ₆ H ₅ -	H	H	3-pyridyl-
III-176	C ₆ H ₅ -	H	H	4-pyridyl-
III-177	C ₆ H ₅ -	H	H	2-thienyl-
III-178	C ₆ H ₅ -	H	H	2-furyl-
III-180	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-181	C ₆ H ₅ -	H	H	

【0038】

【表19】

表 3-10

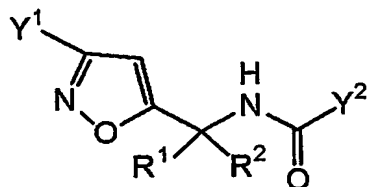


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-182	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-183	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-184	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-185	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-186	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-187	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-188	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-189	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-190	C ₆ H ₅ -	H	H	

【0039】

【表20】

表 3-11

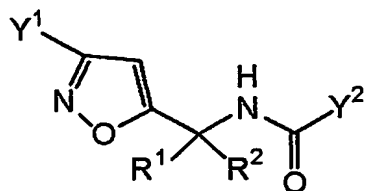


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-191	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-192	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-193	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-194	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-195	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-196	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-197	C ₆ H ₅ -	H	H	

【0040】

【表 21】

表 3-12

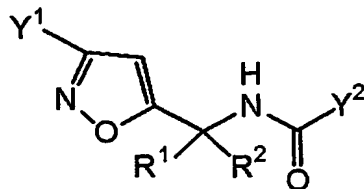


化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-198	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-199	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-200	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-201	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-202	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-203	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-204	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-205	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-206	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	

【0041】

【表22】

表 3-13

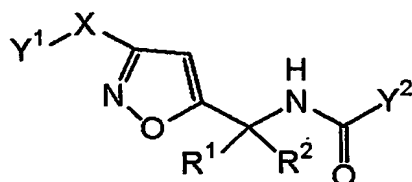


化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-207	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-208	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-209	C ₆ H ₅ -	H	H	Me ₂ C=CH-
III-210		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-211		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -

【0042】

【表23】

表 4-1

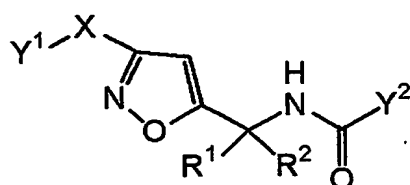


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-1	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -
IV-2	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-3	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-4	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	c-Hex-
IV-5	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	c-Hexyloxy-
IV-6	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-Et-C ₆ H ₄ -
IV-7	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
IV-8	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -
IV-9	4-MeO-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-10	4-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-11	3-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-12	2-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-13	4-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-14	4-NC-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-15	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-16	3-F-4-MeO-C ₆ H ₃ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-17	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-18	2-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-19	3-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-20	4-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-21	2-thienyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-22	2-furyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-23	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -

【0043】

【表24】

表 4-2

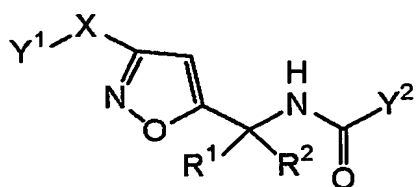


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-24		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-25		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-26		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-27		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-28		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-29	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-30	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-31	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-32	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-33	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	C₆H₅-
IV-34	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-35	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-

【0044】

【表25】

表 4-3

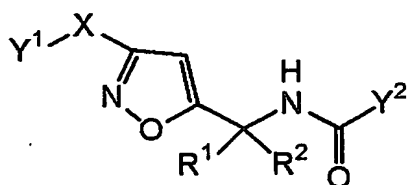


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-36	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-37	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-38	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-39	C ₆ H ₅ -		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-40	C ₆ H ₅ -		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-41	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-42	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-43	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-44	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -
IV-45	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-46	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -

【0045】

【表 26】

表 4-4

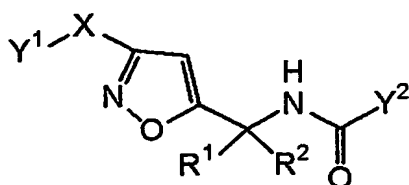


化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-47	2-Me-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-48	3-Me-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-49	3-Me-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-50	4-Me-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-51	2-NC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-52	3-NC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-53	4-NC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-54	2-MeO-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-55	3-MeO-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-56	4-MeO-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-57	2-F-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-58	3-F-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-59	4-F-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-60	4-O₂N-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-61	c-Hex-	-O-CH₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-62	2-pyridyl-	-O-CH₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-63	C₆H₅-	-O-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-64	C₆H₅-	-S-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-65	C₆H₅-	-SO₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-66	C₆H₅-	-NH-	H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-67	C₆H₅-		H	H	4-Me-C₆H₄-
IV-68	C₆H₅-	-CH₂-O-	H	H	4-Me-C₆H₄-

【0046】

【表27】

表 4-5



化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-69	C ₆ H ₅ -		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-70	C ₆ H ₅ -	-CO-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-71	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-72		-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-73		-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-74		-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -

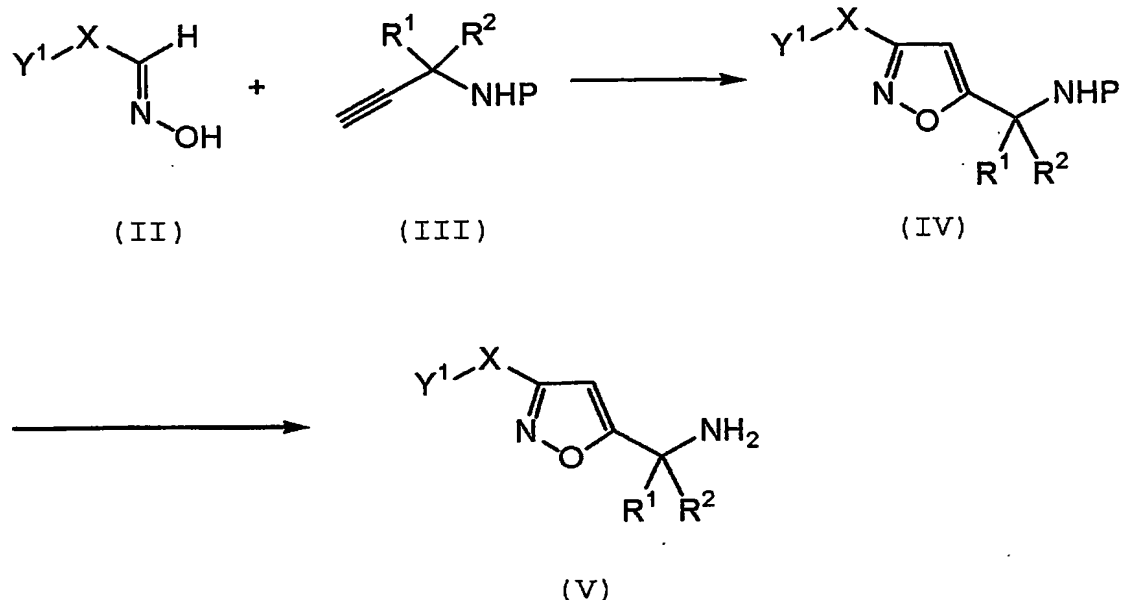
【0047】

【本発明化合物の製造方法】

〔1〕 本発明化合物の製造中間体である置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体（V）は下記反応工程式1に示す方法により製造することができる。

【化 25】

反応工程式 1



(反応工程式中、Pはアミノ基の保護基を表わし、X、Y¹、R¹及びR²は前記と同じ意味を表わす。)

【0048】

すなわち、一般式(II)で表されるオキシム誘導体と一般式(III)で表わされる保護されたプロパルギルアミン誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライト類の存在下で反応させて、一般式(IV)で表わされる置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体の保護体を製造することができる。

【0049】

ここで、アミノ基の保護基としては、t-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基等が用いられる。

【0050】

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム等のアルカリ金属水溶

液等である。

【0051】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類もしくはこれらから選択される任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0052】

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から3日間で完結する。

【0053】

反応中間体である一般式(IV)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0054】

続いて、一般式(IV)の化合物を適当な溶媒中、適当な脱保護条件にて、一般式(V)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾール誘導体を製造することができる。

【0055】

ここで用いられる脱保護条件は保護基によって異なり、例えば α -ブトキシカルボニル基を保護基として使用した場合、塩酸水溶液等のプロトン酸溶液が好ましく、ベンジルオキシカルボニル基を保護基として使用した場合、パラジウムカ

ーボン、ラネーニッケル等の触媒存在下、水素気流下で行うのが好ましい。

【0056】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましい。

【0057】

反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

反応時間は、反応温度、反応基質及び反応試薬により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

【0058】

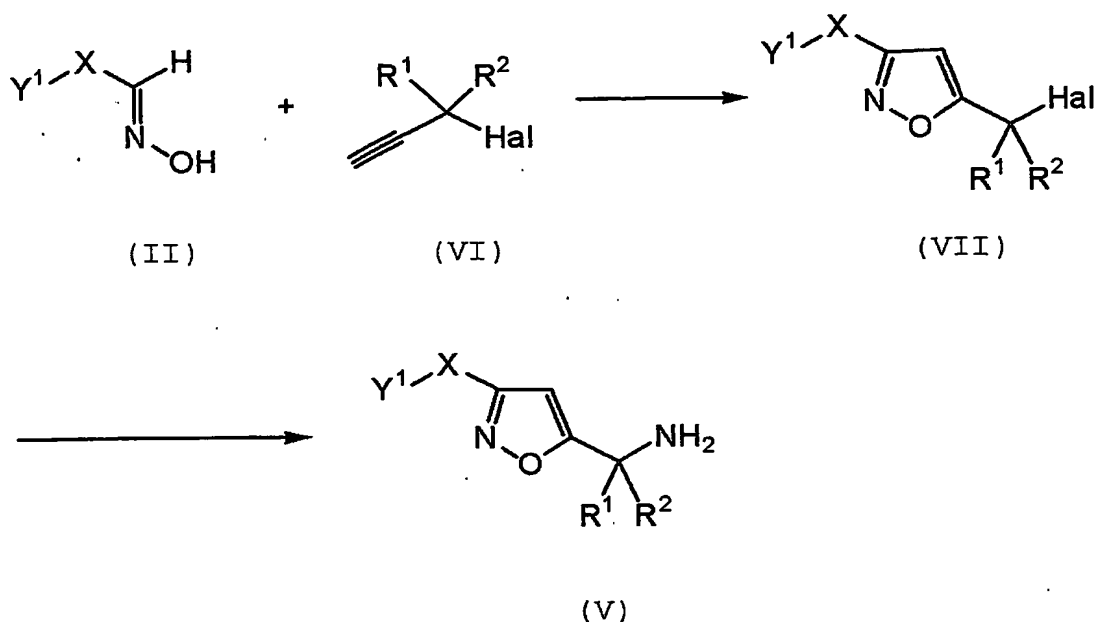
反応中間体である一般式(V)のアミノアルキルイソキサゾール誘導体は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば α -ブトキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。また、ベンジルオキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応触媒を濾過して取り除いた後に、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0059】

[2] また、一般式(V)の置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体は、以下の反応工程式2に示す方法によっても製造できる。

【化 26】

反応工程式 2



(反応工程式中、Hal はハロゲン原子を表わし、X、Y¹、R¹及びR²は前記と同じ意味を表わす。)

【0060】

すなわち、一般式 (II) で表わされるオキシム誘導体と一般式 (VI) で表わされるプロパルギル誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライト類の存在下で反応させて、一般式 (VII) で表わされる5-ハロゲノアルキルイソキサゾール誘導体を製造することができる。

【0061】

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム等のアルカリ金属水溶液等である。

【0062】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの任意の混合溶媒等を挙げることができる。

【0063】

反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から24時間で完結する。

【0064】

反応中間体である一般式(VII)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0065】

続いて、一般式(VII)の化合物を適当な溶媒中、アミン類を用いて、一般式(V)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾールを製造することができる。

【0066】

ここで用いられるアミン類は、ガス状アンモニアもしくはアンモニア-ジオキサン溶液、アンモニア-エチルアルコール溶液、アンモニア-メチルアルコール溶液、アンモニア-2-プロパノール溶液、アンモニア水溶液が用いられる。

【0067】

反応に用いられる溶媒としては反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン

、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられ、好ましくはクロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。

【0068】

反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

【0069】

反応目的物である一般式(V)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0070】

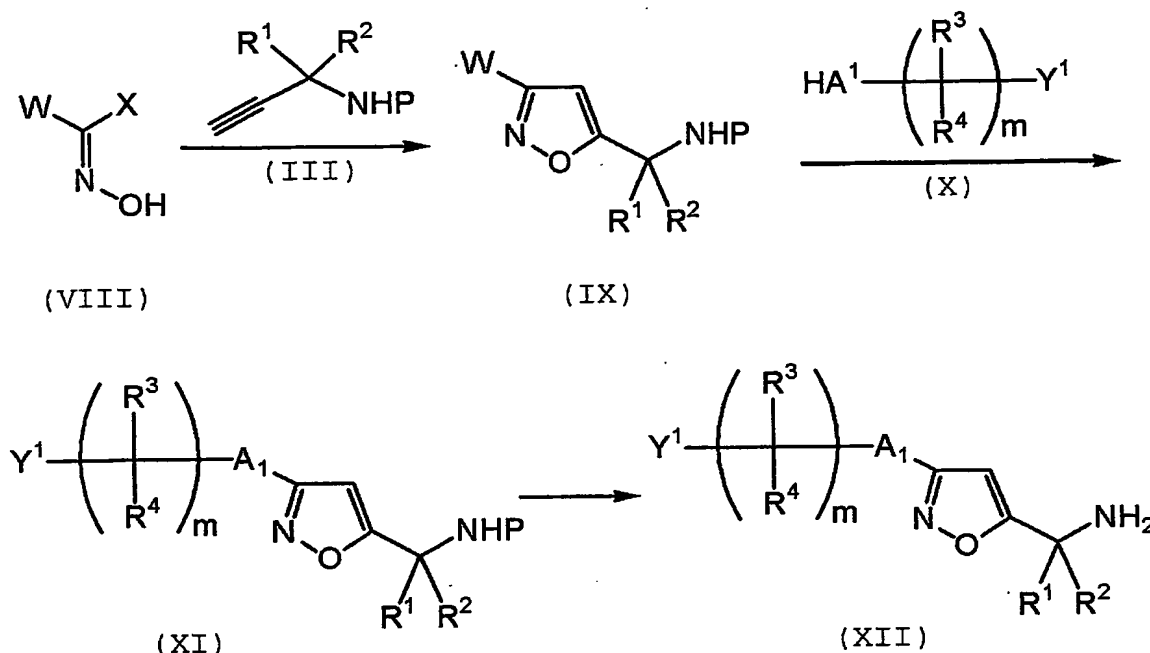
なお、前記した一般式(IV)の置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体は、特開昭52-154525号公報、特表平9-509951号公報、Tetrahedron Letters, Vol.34, No.47, pp7509-7512, 1993、Tetrahedron Letters, 42 (2001)1057-1060、Synthetic Communications, 22(13), 1939-1948 (1992)、Tetrahedron Letters, Vol.27, No.27, pp3181-3182, 1986、Tetrahedron Letters, Vol.33, No.22, pp.3113-3116, 1992などに記載の方法またはそれらに準じた方法により合成することができる。

【0071】

[3] 一般式(XII)で示される置換5-アルキルイソキサゾール誘導体は、以下の反応工程式3に示す方法によって製造することができる。

【化 27】

反応工程式 3



(反応工程式中、 Y^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び m は、前記と同じ意味を表わし、 A^1 は、酸素原子、硫黄原子、 $-NR^{12}-$ 基(式中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わし、 Ha^1 はハロゲン原子を表わし、 P はアミノ基の保護基を表わし、 X はハロゲン原子を表わし、 W はハロゲン原子やトシル基、メシル基等の脱離基を表わす。)

【0072】

すなわち、式(VIII)で示されるハロオキシムと式(III)で示されるプロパルギルアミン誘導体の保護体とを塩基存在下における1, 3-双極子付加反応によって式(IX)で表わされる3-フェニルスルホニルイソキサゾール誘導体の保護体を製造することができる。続いて、式(X)で表わされる求核剤を反応させることによって式(XI)で表わされる5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体の保護体を製造することができる。一般式(XI)で示されるアルキルアミノイソキサゾール誘導体の保護体は、適当な脱保護の条件によって一般式(XII)で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を製造することができる。

【0073】

1, 3-双極子付加反応において使用される塩基としては、例えば、1段階目の反応に用いられる塩基は、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノン-5-エン(DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセ-7-エン(DBU)等の有機塩基等が挙げられる。

【0074】

1, 3-双極子付加反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられ、好ましくはクロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。

【0075】

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

【0076】

反応目的物である一般式(IX)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、溶媒にて抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0077】

一般式(X)で示される化合物の一般式(IX)で示される化合物への求核付加反応に用いられる塩基は、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限な

く使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノン-5-エン(DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセ-7-エン(DBU)等の有機塩基等が挙げられる。

【0078】

一般式(X)で示される化合物の一般式(IX)で示される化合物への求核付加反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0079】

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

【0080】

反応目的物である一般式(XI)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、溶媒にて抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0081】

続いて、一般式(XI)の化合物を適当な溶媒中、適当な脱保護条件にて、一般式(XII)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾール誘導体を製造することができる。

【0082】

ここで用いられる脱保護条件は保護基によって異なり、例えば *t*-ブトキシカルボニル基を保護基として使用した場合、塩酸水溶液等のプロトン酸溶液が好ましく、ベンジルオキシカルボニル基を保護基として使用した場合、パラジウムカーボン、ラネーニッケル等の触媒存在下、水素気流下で行うのが好ましい。

【 0 0 8 3 】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましい。

【 0 0 8 4 】

反応温度は通常 -80 ~ 150℃ であり、好ましくは -15 ~ 50℃ である。

反応時間は、反応温度、反応基質及び反応試薬により異なるが、通常 30 分から 1 週間で完結する。

【 0 0 8 5 】

一般式 (XII) の置換アミノアルキルイソキサゾール誘導体は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば *t*-ブトキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。また、ベンジルオキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応触媒を濾過して取り除いた後に、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【 0 0 8 6 】

なお、一般式 (VIII) で示されるハロオキシムは、文献既知の化合物であり、例えば、Journal of American Chemical Society, 101, (5), 1319-1320, (1979)

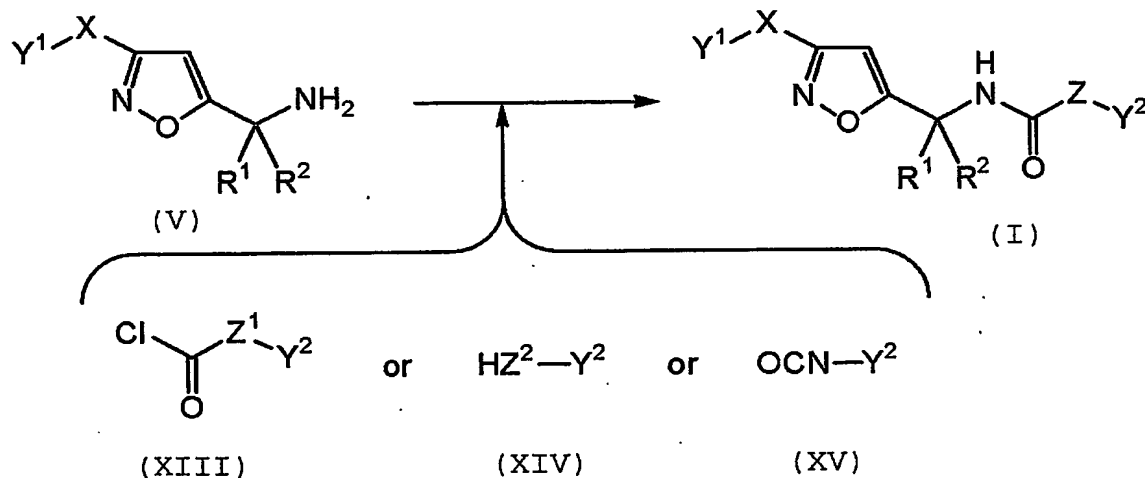
)、Journal of Organic Chemistry, 1988, 53, 5369-5371、Journal of Organic Chemistry, 1983, 46, 1796、Journal of Organic Chemistry, 1984, 49, 4595、Journal of Organic Chemistry, 1987, 52, 2973、特表平11-504651号公報、Synthetic Communications, 22(13), 1939-1948 (1992)、Tetrahedron Letters, Vol.27, No.27, pp3181-3182, 1986、Tetrahedron Letters, Vol.33, No.22, pp3113-3116, (1992)等に、合成方法や関連反応の記載がある。

【0087】

[4] 一般式(I)で表わされる化合物は、下記の反応工程式4に示す方法によって製造できる。

【化28】

反応工程式 4



(反応工程式中、X、Y¹、Y²、R¹、R²及びZは前記と同じ意味を表わし、Z¹はBがNH基以外のZを示し、Z²はBを含むZである場合を示す。)

【0088】

すなわち、置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体(V)に、一般式(XIII)で表わされる酸クロライドまたはそれ以外のカルボニル基が活性化された誘導体を、必要であれば適当な塩基の存在下、適当な溶媒中反応させて一般式(I)で表わされる誘導体を製造することができる。

【0089】

ここで用いられる一般式(XIII)以外のカルボキシル基が活性化された誘導体

としては、例えば一般式 (XIII) の酸無水物、一般式 (XIII) と他の酸や α -アルキル炭酸等が縮合した混合酸無水物、*p*-ニトロフェニルエステル、2-テトラヒドロピラニルエステル及び2-ピリジルエステル等の活性化されたエステル類等を挙げることができる。

【0090】

ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン、ピリジン、*N*-メチルピペリジン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン (DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセ-7-エン (DBU) 等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、*N*-メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。

【0091】

反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0092】

反応温度は通常 $-80 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、好ましくは $-15 \sim 50^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

【0093】

反応目的物である一般式 (I) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去

することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0094】

なお、この反応では、一般式(V)で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式(XII)で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

【0095】

また、一般式(I)の化合物は、一般式(XIV)で示されるアルコール誘導体、チオール誘導体、一級アミノ誘導体、2級アミノ誘導体を適当な溶媒存在下、適当な縮合剤を必要であれば適当な塩基存在下に反応させ、得られた活性種に対して一般式(V)の置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体を作用させることで製造することもできる。

【0096】

ここで用いられる縮合剤としては、N, N'-カルボジリジイミダゾール、4-ニトロフェノキシカルボニルクロライド、ホスゲン、トリホスゲン等が挙げられる。

【0097】

ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノン-5-エン(DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセ-7-エン(DBU)等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。

【0098】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、

エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0099】

反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

【0100】

反応目的物である一般式(I)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0101】

なお、この反応では、一般式(V)で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式(XII)で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

【0102】

また、一般式(I)の化合物は、一般式(XV)のイソシアネート誘導体を一般式(V)の置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体反応させることで製造することもできる。

【0103】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0104】

反応温度は通常 $-80\sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、好ましくは $-15\sim 50^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

【0105】

反応目的物である一般式 (I) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0106】

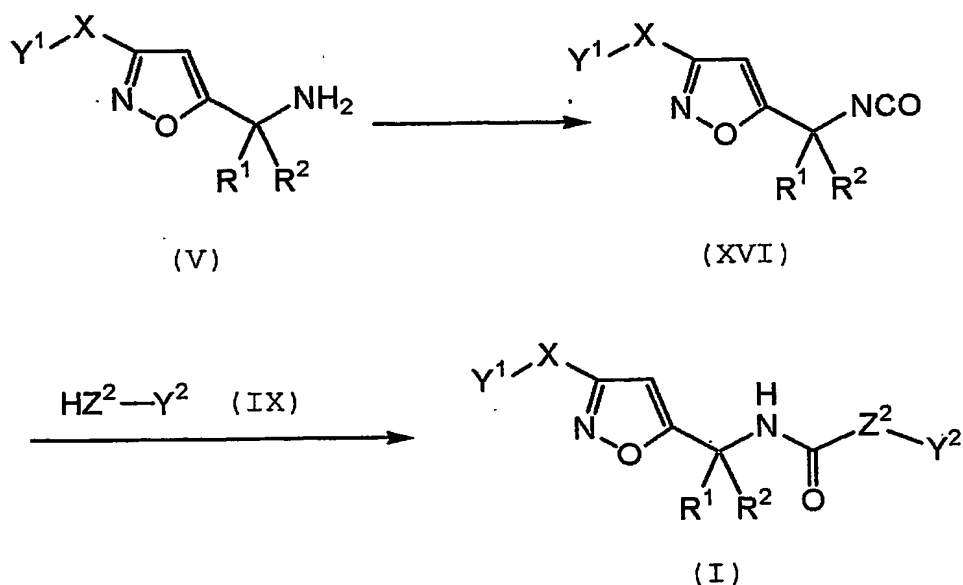
なお、この反応では、一般式 (V) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式 (XII) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

【0107】

[5] 一般式 (I) で表わされる誘導体は、下記の反応工程式 5 に示す方法によっても製造できる。

【化29】

反応工程式 5



(反応工程式中、 X 、 Y^1 、 Y^2 、 R^1 、 R^2 及び Z^2 は、前記と同じ意味を表わす)

。)

【0108】

すなわち、置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体(V)に、ホスゲンもしくはトリホスゲンを用い、必要であれば適当な塩基の存在下、適当な溶媒中反応させて一般式(XVI)で表わされるイソシアネート誘導体を製造することができる。

【0109】

ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセ-7-エン(DBU)等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。

【0110】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【0111】

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~100℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

【0112】

反応目的物である一般式 (XVI) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【 0 1 1 3 】

なお、この反応では、一般式 (V) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式 (XII) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

【 0 1 1 4 】

続いて、一般式 (I) の化合物は、一般式 (IX) で示されるアルコール誘導体、チオール誘導体、一級アミノ誘導体、2級アミノ誘導体を適当な溶媒存在下、イソシアネート誘導体 (XVI) と反応させることで製造することもできる。

【 0 1 1 5 】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

【 0 1 1 6 】

反応温度は通常 - 8 0 ~ 1 5 0 °C であり、好ましくは - 1 5 ~ 5 0 °C である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常 3 0 分から 4 8 時間で完結する。

【 0 1 1 7 】

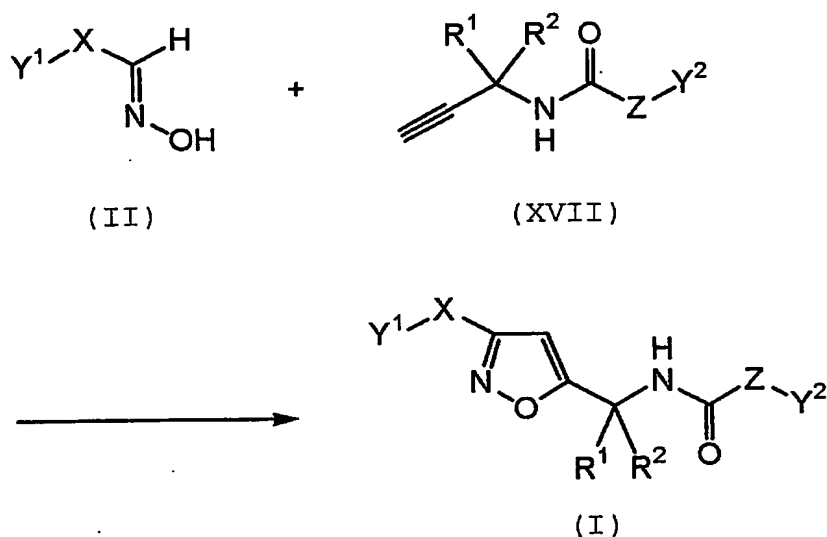
反応目的物である一般式 (I) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【 0 1 1 8 】

[6] また一般式 (I) で表わされる置換 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体は、下記反応工程式 6 に示す方法でも製造することができる。

【化 30】

反応工程式 6



(反応工程式中、X、 Y^1 、 Y^2 、 R^1 、 R^2 、Z は、前記と同じ意味を表わす。)

【0119】

すなわち、一般式 (II) で表わされるオキシム誘導体と式 (XVII) で表わされるプロパルギルアミン誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライト類の存在下で反応させて、一般式 (I) で表わされる誘導体を製造することができる

【0120】

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム等のアルカリ金属水溶液等である。

【0121】

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、

エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類を挙げることができる。

【0122】

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から24時間で完結する。

【0123】

一般式(I)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

【0124】

なお、化合物(II)のアルドキシム類は、対応するアルデヒド類より、ヒドロキシルアミン塩酸塩と、酢酸ナトリウム等の塩基を用いてエタノール等のアルコール溶媒中で常温もしくは加熱還流条件下で製造することができる。

また、一般式(XVII)のプロパルギルアミン誘導体は、プロパルギルアミンから、クロロギ酸エステル類、イソシアネート類、酸クロライド類等を用いて製造することができる。

【0125】

【農園芸殺菌剤としての適用】

一般式(I)または(IA)で示される化合物は、有害生物防除作用を有し、農園芸用殺菌剤として使用することができる。

【0126】

本発明化合物が優れた防除効果を示す植物病害としては、

イネいもち病 (Pyricularia oryzae) 、
イネ紋枯病 (Rhizoctonia solani) 、
イネ馬鹿苗病 (Gibberella fujikuroi) 、
オオムギうどんこ病 (Erysiphe graminis f.sp. tritici) 、
コムギうどんこ病 (Erysiphe graminis f.sp. hordei) 、
コムギ眼紋病 (Pseudocercospora herpotrichoides) 、
コムギ黒さび病 (Puccinia graminis) 、
コムギ炭疽病 (Colletotrichum graminicola) 、
コムギ葉枯病 (Septoria tritici) 、
コムギ雲形病 (Phycothosporium secalis f.sp. hordei) 、
ジャガイモ疫病 (Phytophthora infestans) 、
ジャガイモ夏疫病 (Alternaria solani) 、
ジャガイモ炭疽病 (Colletotrichum atramentarium) 、
ジャガイモ黒あざ病 (Thanatephorus cucumeris) 、
ジャガイモ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
アズキうどんこ病 (Erysiphe pisi) 、
アズキ褐斑病 (Cercospora canescens) 、
アズキ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
アズキ炭疽病 (Colletotrichum phaseolorum) 、
インゲンマメ褐斑病 (Cercospora canescens) 、
インゲンマメ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
インゲンマメ炭疽病 (Colletotrichum lindemuthianum) 、
インゲンマメ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
ダイズ炭疽病 (Colletotrichum truncatum) 、
ダイズ紫斑病 (Cercospora kikuchii) 、
ダイズさび病 (Phakopsora pachyrhizi) 、
コンニャク炭疽病 (Gloeosporium conjac) 、
コンニャク褐斑病 (Septoria perillae) 、
チャ炭疽病 (Colletotrichum theae-sinensis) 、

ホウレンソウ褐斑病 (Cercospora beticola) 、
 ホウレンソウ炭疽病 (Colletotrichum spinaciae) 、
 ホウレンソウベと病 (Peronospora effusa) 、
 キャベツ黒斑病 (Alternaria brassicae) 、
 キャベツ黒すす病 (Alternaria brassicicola) 、
 キャベツ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 キャベツ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 コマツナ炭疽病 (Colletotrichum higginsianum) 、
 ハクサイ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 ハクサイ黒斑病 (Alternaria brassicae、Alternaria brassicicola) 、
 カボチャ黒斑病 (Alternaria cucumerina) 、
 カボチャ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 カボチャベと病 (Pseudoperonospora cubensis) 、
 キュウリうどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea) 、
 キュウリ疫病 (Phytophthora melonis) 、
 キュウリ褐斑病 (Corynespora cassiicola) 、
 キュウリ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 キュウリ黒斑病 (Alternaria cucumerina) 、
 キュウリ炭疽病 (Colletotrichum lagenarium) 、
 キュウリつる割病 (Fusarium oxysporum f.sp. cucumerinum) 、
 キュウリ苗立枯病 (Pythium cucurbitacearum、Rhizoctonia solani) 、
 キュウリ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 キュウリホモプシス根腐病 (Phomopsis sp.) 、
 キュウリベと病 (Pseudoperonospora cubensis) 、
 スイカうどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea) 、
 スイカ疫病 (Phytophthora cryptogea) 、
 スイカ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 スイカ炭疽病 (Colletotrichum orbiculare) 、
 スイカベと病 (Pseudoperonospora cubensis) 、

メロン褐斑病 (Corynespora cassiicola) 、
 メロン菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 メロンつる割病 (Fusarium oxysporum f.sp. melonis) 、
 メロンベと病 (Pseudoperonospora cubensis) 、
 シュンギク萎凋病 (Fusarium oxysporum) 、
 シュンギク菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 シュンギクさび病 (Puccinia cnici-oleracei) 、
 シュンギク炭疽病 (Gloeosporium chrysanthemi、Gloeosporium carthami) 、
 ニンジン萎凋病 (Fusarium oxysporum) 、
 ニンジンうどんこ病 (Erysiphe heraclei) 、
 ニンジン菌核病 (Sclerotinia intermedia、Sclerotinia sclerotiorum) 、
 ニンジン黒葉枯病 (Alternaria dauci) 、
 ニンジン黒斑病 (Alternaria radicina) 、
 トウガラシ・ピーマン萎凋病 (Fusarium oxysporum) 、
 トウガラシ・ピーマンうどんこ病 (Oidiopsis sicula) 、
 トウガラシ・ピーマン疫病 (Phytophthora capsici) 、
 トウガラシ・ピーマン菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 トウガラシ・ピーマン炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides) 、
 トウガラシ・ピーマン灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 トマト萎凋病 (Fusarium oxysporum f.sp. lycopersici) 、
 トマトうどんこ病 (Oidiopsis sicula) 、
 トマト疫病 (Phytophthora infestans) 、
 トマト菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 トマト灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 トマト葉かび病 (Fulvia fulva) 、
 ナス疫病 (Phytophthora infestans) 、
 ナス褐色斑点病 (Thanatephorus cucumeris) 、
 ナス褐色腐敗病 (Phytophthora capsici) 、
 ナス菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、

ナス褐斑病 (Alternaria solani)、
イチゴ萎黄病 (Fusarium oxysporum)、
イチゴ萎凋病 (Verticillium dahliae)、
イチゴうどんこ病 (Sphaerotheca humuli)、
イチゴ疫病 (Phytophthora nicotianae var. parasitica)、
イチゴ果実腐敗病 (Pythium ultimum var. ultimum)、
イチゴ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum)、
イチゴ黒斑病 (Alternaria alternata)、
イチゴ蛇の目病 (Mycosphaerella fragariae)、
イチゴ炭疽病 (Colletotrichum acutatum, Glomerella cingulata)、
イチゴ灰色かび病 (Botrytis cinerea)、
アスパラガス褐斑病 (Cercospora asparagi)、
アスパラガス茎枯病 (Phomopsis asparagi)、
アスパラガスさび病 (Puccinia asparagi-lucidi)、
アスパラガス炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides)、
アスパラガス灰色かび病 (Botrytis cinerea)、
タマネギ疫病 (Phytophthora nicotianae)、
タマネギ黄斑病 (Cladosporium allii-cepae)、
タマネギ乾腐病 (Fusarium oxysporum f.sp. cepae)、
タマネギ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum)、
タマネギ黒点葉枯病 (Septoria alliacea)、
タマネギにせ黒斑病 (Alternaria porri)、
タマネギさび病 (Puccinia allii)、
タマネギ小菌核病 (Puccinia allii)、
タマネギ小菌核性腐敗病 (Botrytis squamosa)、
タマネギ白色疫病 (Phytophthora porri)、
タマネギ炭疽病 (Colletotrichum circinans)、
タマネギ黒斑病 (Alternaria sp.)、
タマネギ灰色かび病 (Botrytis cinerea)、

タマネギ灰色腐敗病 (Botrytis allii)、
 タマネギ葉枯病 (Pleospora herbarum)、
 タマネギベと病 (Peronospora destructor)、
 ニラさび病 (Puccinia allii)、
 ニラ白斑葉枯病 (Botrytis byssoidea)、
 ネギ疫病 (Phytophthora nicotianae)、
 ネギ萎凋病 (Fusarium oxysporum)、
 ネギ黒渋病 (Mycosphaerella allicina)、
 ネギ黒点葉枯病 (Septoria alliacea)、
 ネギ黒斑病 (Alternaria porri)、
 ネギ小菌核病 (Sclerotinia allii)、
 ネギさび病 (Puccinia allii)、
 ネギ小菌核腐敗病 (Botrytis squamosa)、
 ネギ白色疫病 (Phytophthora porri)、
 ネギ炭疽病 (Colletotrichum circinans)、
 ネギベと病 (Peronospora destructor)、
 マンゴー炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides)、
 カキうどんこ病 (Phyllactinia kakicola)、
 カキ汚染果病 (Colletotrichum ssp., Glomerella sp.)、
 カキ角斑病 (Cercospora kakivora)、
 カキ角斑落葉病 (Cercospora kaki)、
 カキ褐紋病 (Macrophoma kaki)、
 カキ黒星病 (Fusicladium levieri)、
 カキ黒点病 (Phomopsis kakivora)、
 カキ黒斑病 (Pseudocercospora fuliginosa)、
 カキ縮葉病 (Physalospora kaki)、
 カキすす病 (Aureobasidium pullulans, Capnophaeum fuliginodes, Cladospori
um herbarum, Microxyphium sp., Scorias communis, Tripospermum juglandis
)、

カキすす点病 (Zygophiala jamaicensis) 、
 カキ炭疽病 (Gloeosporium kaki) 、
 カキ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 カキ葉枯病 (Pestalotia diospyri) 、
 カキ葉炭疽病 (Glomerella cingulata) 、
 カキ円星落葉病 (Mycosphaerella nawae) 、
 ウメうどんこ病 (Podosphaera tridactyla、Sphaerotheca pannosa) 、
 ウメ枝枯病 (Botryosphaeria dothidea) 、
 ウメ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 ウメ黒星病 (Cladosporium carpophilum) 、
 ウメ白さび病 (Leucotelium pruni-persicae) 、
 ウメ白紋羽病 (Rosellinia necatrix) 、
 ウメ心腐病 (Fusarium lateritium) 、
 ウメせん孔病 (Pseudocercospora circumscissa) 、
 ウメそうか病 (Sphaceloma pruni-domesticae) 、
 ウメ炭疽病 (Glomerella cingulata) 、
 ウメ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 ウメ灰星病 (Monilinia fructicola、Monilinia laxa) 、
 ウメ葉炭疽病 (Glomerella nune) 、
 オウトウ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 オウトウうどんこ病 (Podosphaera tridactyla) 、
 オウトウ黒かび病 (Rhizopus nigricans) 、
 オウトウ炭疽病 (Glomerella cingulata) 、
 オウトウ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 オウトウ灰星病 (Monilinia fructicola) 、
 セイヨウナシうどんこ病 (Phyllactinia mali) 、
 セイヨウナシ疫病 (Phytophthora cactorum、Phytophthora syringae) 、
 セイヨウナシ黒星病 (Venturia pirina) 、
 セイヨウナシ炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides) 、

ナシ赤星病 (Gymnosporangium asiaticum) 、
 ナシうどんこ病 (Phyllactinia pyri) 、
 ナシ疫病 (Phytophthora cactorum、Phytophthora syringae) 、
 ナシ黒星病 (Venturia nashicola) 、
 ナシ黒斑病 (Alternaria kikuchiana) 、
 ナシすす点病 (Leptothyrium pomi) 、
 ナシ炭疽病 (Glomerella cingulata) 、
 ナシ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 ナシ灰星病 (Monilinia fructigena) 、
 ナシ葉炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides) 、
 ナシ輪紋病 (Physalospora piricola) 、
 モモ赤かび病 (Fusarium oxysporum、Gibberella zeae) 、
 モモうどんこ病 (Podosphaera tridactyla、Sphaerotheca pannosa) 、
 モモ菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum) 、
 モモ黒かび病 (Rhizopus nigricans) 、
 モモ黒星病 (Cladosporium carpophilum) 、
 モモ白さび病 (Leucotelium pruni-persicae) 、
 モモすすかび病 (Stenella sp.) 、
 モモせん孔病 (Pseudocercospora circumscissa、Phyllosticta persicae) 、
 モモ炭疽病 (Gloeosporium laeticolor) 、
 モモ灰色かび病 (Botrytis cinerea) 、
 もオ灰星病 (Monilinia fructicola) 、
 モモホモプシス腐敗病 (Phomopsis sp.) 、
 リンゴ赤星病 (Gymnosporangium yamadae) 、
 リンゴうどんこ病 (Podosphaera leucotricha) 、
 リンゴ疫病 (Phytophthora cactorum、Phytophthora cambivora、Phytophthora syringae) 、
 リンゴ褐斑病 (Diplocarpon mali) 、
 リンゴ環紋葉枯病 (Cristulariella moricola) 、

リンゴ黒星病 (Venturia inaequalis)、
 リンゴすす点病 (Zygophiala jamaicensis)、
 リンゴ炭疽病 (Glomerella cingulata)、
 リンゴ灰色かび病 (Botrytis cinerea)、
 リンゴ斑点落葉病 (Alternaria alternata)、
 ブドウうどんこ病 (Uncinula necator)、
 ブドウ枝枯菌核病 (Sclerotinia sclerotiorum)、
 ブドウ晩腐病 (Glomerella cingulata)、
 ブドウ褐斑病 (Pseudocercospora vitis)、
 ブドウ褐斑葉枯病 (Briosia ampelophaga)、
 ブドウ黒とう病 (Elsinoe ampelina)、
 ブドウ黒腐病 (Phyllosticta ampellicida)、
 ブドウつる割病 (Phomopsis viticola)、
 ブドウべと病 (Plasmopara viticola)、
 クリ炭疽病 (Glomerella cingulata)、
 クリすす病 (Capnodium salicinum)、
 クリ褐斑病 (Morenoella quercina)、
 クリうどんこ病 (Microsphaera alphitoides)、
 クリ葉枯病 (Monochaetia monochaeta)、
 カンキツ灰色かび病 (Botrytis cinerea)、
 カンキツ褐色腐敗病 (Phytophthora citrophthora)、
 カンキツ黒点病 (Diaporthe citri)、
 カンキツ黄斑病 (Mycosphaerella citri、Mycosphaerella horii)、
 カンキツそうか病 (Elsinoe fawcettii)、
 カンキツそばかす病 (Mycosphaerella pinodes)、
 カンキツ炭疽病 (Colletotrichum gloeosporioides)、
 カンキツさび果病 (Colletotrichum gloeosporioides) 等があげられる。

【0127】

本発明による化合物の適用は、植物に噴霧、散布、塗布等して処理するか、ま

たは植物の種子、または植物の周囲の土壌あるいは種子を播種する土壌、水田、水耕栽培の水を有効成分で処理することにより行うことができる。適用は植物が病原菌に感染する前または感染後に行うことができる。

【 0 1 2 8 】

本発明の化合物は、農薬製剤で汎用されている担体、界面活性剤、または補助剤などを配合し、製剤化して使用することができる。

【 0 1 2 9 】

製剤の態様としては、懸濁剤、油剤、乳剤、液剤、水溶剤、水和剤、フロアブル剤、ペースト剤、粒剤、粉剤、錠剤、顆粒状水和剤、燻煙剤、エアロゾル剤、泡沫剤、マイクロカプセル剤、ジャンボ剤、種子用被覆剤、ULV（コールドミスト、ウォームミスト）剤などのような剤型が挙げられる。このような態様は、少なくとも一種の本発明化合物と適当な固体担体、液体担体、液体ガス状担体等の担体類、及び所望により、有効成分の分散性や、他の性質の改善のために適当な補助剤（例えば、界面活性剤、展着剤、分散剤、安定剤）とともに混合する通常の方法によって製造することができる。

【 0 1 3 0 】

固体の担体の例としては、植物性物質（例えば結晶性セルロース、デンプン、木粉、コルク、コーヒー殻等）、繊維状物質、人工の可塑性粉末、粘土（例えば、カオリン、ベントナイト、白土、珪藻土、合成含水酸化珪素、フバサミクレー、酸性白土等）、タルク及び無機物（パーミキュライト、モンモリロナイト、軽石、硫黄粉末、リン灰石、雲母、セリサイト、石英粉末、活性炭、炭酸カルシウム等）、高分子化合物（ポリ塩化ビニル、石油樹脂等）、化学肥料（硫安、憐安、硝安、塩安、塩化カルシウム、尿素等）などが挙げられる。

【 0 1 3 1 】

液体の担体類及び希釈剤の例としては、水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、シクロヘキサノール、アルミアルコール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（エチルセロソルブ、ブチルセロソルブ、ジオキサン等）、芳香族炭化水素（ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪

族炭化水素（ケロシン、イソパラフィン、ノルマルパラフィン）、エステル類（酢酸イソプロピル、酢酸ベンジル等）、ニトリル類、アミド類（N，N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等）、ハロゲン化炭化水素（クロロベンゼン、トリクロロエチレン等）などが挙げられる。

【0132】

ガス状担体、すなわち噴射剤としては、例えば炭酸ガス、ブタンガス、フルオロカーボンなどが挙げられる。

【0133】

界面活性剤の例としては、アルキル硫酸エステル、スルホン酸アルキル、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体などが挙げられる。

【0134】

その他の製剤用補助剤の例としては、カゼイン、ゼラチン、多糖類（澱粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ペントナイト、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸等）などの固着剤や分散剤、PAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT（2，6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノール）、植物油、糖蜜、寒天、鉱物油、脂肪酸、脂肪酸エステルなどの安定剤が挙げられる。

【0135】

一般に、上記製剤は、少なくとも一種の本発明化合物（I）を、0.1～95重量%、好ましくは1～80重量%含む。これらの製剤は単独でまたは希釈して、植物に噴霧、散布、塗布等して処理するか、または植物の種子、または植物の周囲の土壌あるいは種子を播種する土壌、水田、水耕栽培の水に処理することができる。本発明による化合物を植物に噴霧、散布、塗布する場合、約1～50000ppm、好ましくは約50～1000ppmの濃度で使用し、植物の周囲の土壌、あるいは水田の水に処理する場合、約1g～5kg/ヘクタール、好ましくは約2g～100g/ヘクタールの量で使用し、種子を播種する土壌に処理す

る場合、通常約 $0.1 \text{ g} \sim 1 \text{ kg} / \text{m}^2$ 、好ましくは $0.5 \text{ g} \sim 500 \text{ g} / \text{m}^2$ の量で使用する。

【0136】

本発明の化合物は、効果の拡大のために、他の農薬成分（殺菌剤、殺細菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調節剤等）の一種またはそれ以上と組み合わせることで製剤化することができる。以下にかかる農薬の例を示すが、組み合わせる農薬の例は、これに限定されるものではない。

【0137】

組み合わせる殺菌剤の例としては、アシベンゾラルー S-メチル、アゾキシストロピン、イソプロチオラン、イブコナゾール、イプロジオン、イプロバリカルブ、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、エポキシコナゾール、塩基性塩化銅、オキサジキシル、カスガマイシン、カルプロパミド、キノキシフェン、キャプタン、クレソキシムメチル、クロロタロニル、ジアゾファミド、ジエトフェンカルブ、ジクロシメット、ジクロメジン、ジチアノン、ジネブ、シメコナゾール、ジメチリモール、シプロコナゾール、シモキサニル、シルチオファム、ストレプトマイシン、スピロキサミン、スルフェン酸、チアベンザゾール、チオファネートメチル、チウラム、チフルザミド、テクロフタラム、テブコナゾール、トリアジメホン、トリアジン、トリシクラゾール、トリフルミゾール、トリフロキシストロピン、トリホリン、トルクロホスメチル、ノニフェノールスルホン酸銅、パクロブトラゾール、バリダマイシン、ピコキシストロピン、ヒドロキシイソキサゾール、ピラクロストロピン、ピロキロン、ファモキサドン、フェナリモル、フェノキサニル、フェリムゾン、フェンヘキサミド、フサライド、ブラストサイジン S、フラメトピル、フルアジナム、フルキノコナゾール、フルジオキシニル、フルトラニル、プロクロラズ、プロシミドン、プロピコナゾール、プロベナゾール、ペフラゾエート、ペノミル、ペンシクロン、ホセチル、ポリオキシシン、マンゼブ、メタラキシル、メトミノストロピン、メバニピリム、メプロニル、有機銅、有機ニッケル、エディフェンフォス、イプロベンフォスなどが挙げられる。

【0138】

組み合わせる殺細菌剤の例としては、テクロフタラム、オキシリニック酸などが挙げられる。

【0139】

組み合わせる殺虫剤の例としては、アセタミプリド、アセフェート、イソキサチオン、イミダクロプリド、エチオフエンカルブ、エチルチオメトン、エトフェンプロックス、オキサミル、カルタップ、カルボスルファン、クロチアニジン、クロマフェノジド、クロルピリホスメチル、シクロプロトリン、ジノテフラン、ジメチルピンホス、ジメトエート、シフルトリン、ジプロフェジン、シラフルオフェン、スピノサド、スルプロホス、ダイアジノン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオシクラム、チオメトン、テブフェノジド、ニテンピラム、バミドチオン、ピメトロジン、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、フィプロニル、フォプロニル、ブプロフェジン、フラチオカルブ、フルシトリネート、フルバリネート、プロパホス、ペルメトリン、ペンスルタップ、ベンチアゾール、ベンフラカルブ、マラソン、メタスルホカルブ、モノクロトホス、マラソン、フェノブカルブ、テトラクロルピنفォス、トリクロルフォン、EPN、イプロベンフォス、フェニトロチオン、イソプロカルブ、カルバリル、フェントエート、プロボキスル、XMCなどが挙げられる。

【0140】

組み合わせる殺虫剤の例としては、エトキサゾール、ケルセン、酸化フェンブタズ、テブフェンピラド、ハルフェンプロックス、ピフェナゼート、ピリミジフェン、ピリミホスメチル、フェンプロパトリン、フルバリネート、ホサロン、ミルベメクチン、プロパルギッド、ジクロルボスなどが挙げられる。

【0141】

組み合わせる除草剤の例としてはアイオキシニル、アジムスルフロン、アシュラム、アトラジン、アニロホス、アラクロール、イマザモックスアンモニウム塩、イマゾスルフロン、インダノファン、エスプロカルブ、エトキシスルフロン、エトベンザニド、塩素酸塩、オキサジクロメフォン、カフェンストロール、キザロホップエチル、クミルロン、グリホサートアンモニウム塩、グリホサートイソプロピルアミン塩、グリホサートトリメシウム塩、グリホサートナトリウム塩、

グリホシネート、クレトジム、クロメプロップ、シアナジン、シクロスルファミロン、ジクワット、シハラホップブチル、シハラホップメチル、ジフルフェニカン、ジメタメトリン、ジメテナミド、シメトリン、ジメピペレート、シンメチリン、石灰窒素、セトキシジム、ダイムロン、チフェンスルフロンメチル、テニルクロール、テブラロキシジム、トリフルラリン、ナプロアニリド、パラコート、ハロスルフロンメチル、ピアラホス、ビスピリバックナトリウム塩、ピフェノックス、ピペロホス、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロンエチル、ピラゾレート、ピラフルフェンエチル、ピリデート、ピリブチカルブ、ピリミノバックメチル、フェノキサプロップエチル、フェントラザミド、ブタクロール、ブタミホス、フルアジホップ、プレチラクロール、プロメトリン、プロモブチド、ペラルゴン酸、ベンズルフロンメチル、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ベンタゾン、ベンチオカーブ、ペンディメタリン、ペントキサゾン、ペンフレセート、メチルイソシアネート、メトラクロール、メトリブジン、メフェナセット、モリネート、リニュロン、レナシル、キノクラミン、シマジン、ジクロベニル、ジウロン、プロパニル、クロルプロファミン、MCPAエチル、MCPAチオエチル、MCPAナトリウム塩、MCPB、ペンスリド、2, 4-PAなどが挙げられる。

【0142】

組み合わせる植物成長制御剤としては、イナベンフィド、インドール酢酸、ウニコナゾール、過酸化カルシウム、ニコチン酸アミド、パクロブトラゾール、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリンなどが挙げられる。

【0143】

【実施例】

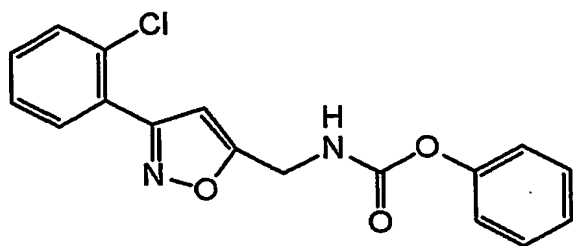
次に、本発明化合物の製造例及び本発明化合物の試験例を挙げて説明するが、本発明は下記に限定されるものではない。

実施例中、 $^1\text{H-NMR}$ は、内部標準としてテトラメチルシラン、溶媒として CDCl_3 を用い、日立社製R-1900型スペクトルメーター(90MHz)にて測定したものを δ 値(ppm)として示した。ただし、 CDCl_3 に難溶な化合物は、 $\text{DMSO}-d_6$ を適量添加して測定を行った。

【0144】

実施例1：{ [3-(2-クロルフェニル)-5-イソオキサゾリル] メチル }
カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号I-28）：

【化31】



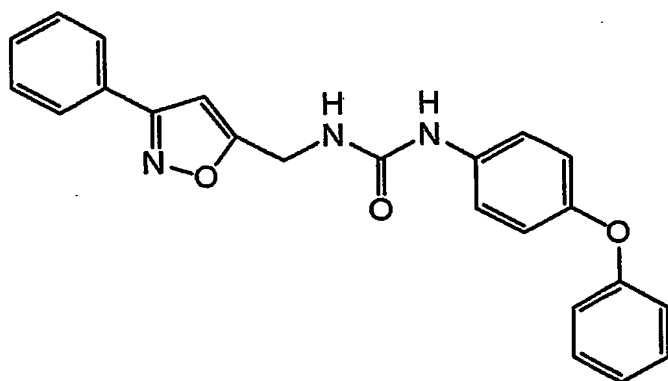
5-アミノメチル-3-(2-クロルフェニル)イソオキサゾール0.51g
とジイソプロピルエチルアミン0.38gのジクロロメタン30mlの溶液にク
ロロギ酸フェニル0.46gを0℃にて加え、室温まで昇温した後5時間攪拌し
た。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに
て精製して、下記物性を有する無色油状の目的物を0.75g得た。

NMR： δ 4.52(2H,d), 5.49-5.88(1H,brs), 6.48(1H,s), 6.99-7.80(9H,m)。

【0145】

実施例2：3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-(4-
フェノキシフェニル)尿素の製造（化合物番号II-42）：

【化32】



5-アミノメチル-3-フェニルイソキサゾール0.82gのエタノール40
ml溶液に、p-フェノキシフェニルイソシアネート1.00gを室温にて加え
た後、一晚攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮した後、析出した結晶を濾取し、イ
ソプロピルエーテルにて洗浄し、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.60

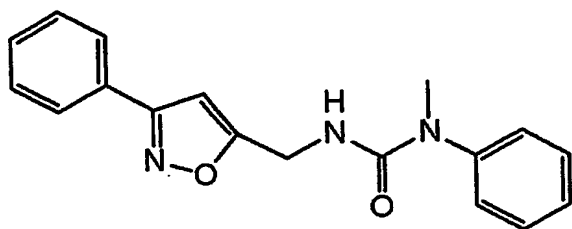
g 得た。

融点：179～181℃。

【0146】

実施例3：3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-メチル-1-フェニル尿素の製造（化合物番号II-12）：

【化33】

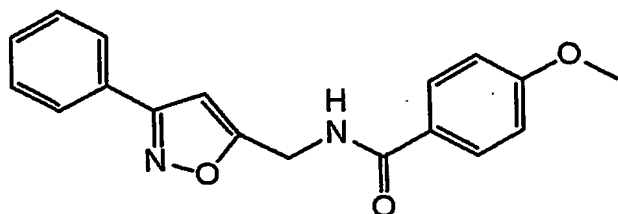


5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール1.00gとジイソプロピルエチルアミン0.89gのジクロロメタン20mlの溶液にN-メチルN-フェニルカルバモイルクロライド0.97gを0℃にて加え、室温まで昇温した後一晩攪拌した。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.48g得た。
融点：114～117℃。

【0147】

実施例4：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号III-111）：

【化34】



5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール0.60gとジイソプロピルエチルアミン0.53gのジクロロメタン30ml溶液にp-メトキシベンゾイルクロライド0.59gを0℃にて加え、室温まで昇温した後一晩攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて

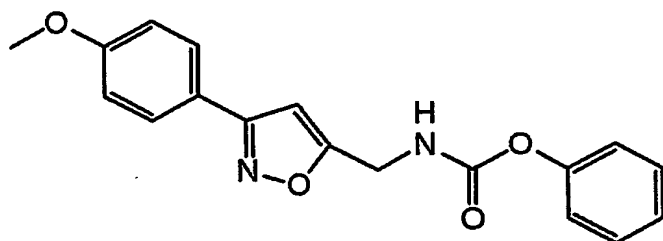
精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を0.90 g得た。

融点：182～184℃。

【0148】

実施例5：{[3-(4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}
カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号I-26）：

【化35】



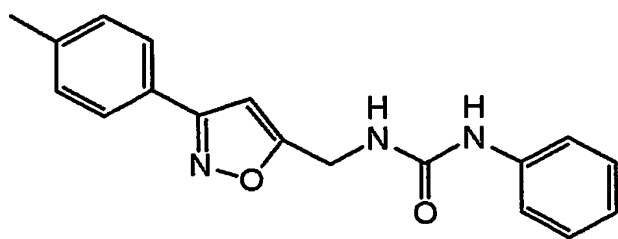
4-メトキシベンズアルドキシム2.00 g及び2-プロピニルカルバミン酸フェニル2.78 gのジクロロメタン50 ml溶液に10%次亜塩素酸ナトリウム水溶液11.8 gを0℃にて30分かけて滴下した。室温に昇温した後、5時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色粉末の目的物を2.25 g得た。

融点：102～105℃。

【0149】

実施例6：3-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-1-フェニル尿素の製造（化合物番号II-2）：

【化36】



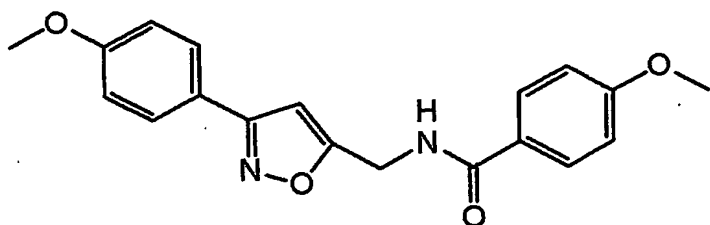
4-メチルベンズアルドキシム4.66 g及び3-(2-プロピニル)-1-フェニル尿素1.50 gのジクロロメタン50 ml溶液に7.0%次亜塩素酸ナ

トリウム水溶液 36.6 g を 0℃ にて 1 時間かけて滴下した。室温に昇温した後、7 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色粉末の目的物を 1.87 g 得た。
融点：176～178℃。

【0150】

実施例 7：N-〔3-〔4-メトキシフェニル〕-5-イソオキサゾリル〕メチル-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-18）：

【化 37】



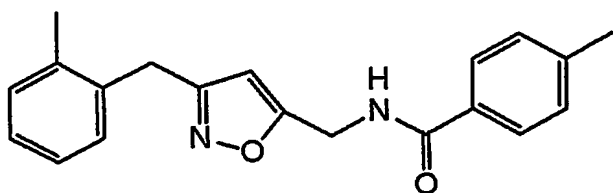
4-メトキシベンズアルドキシム 4.90 g 及び N-(2-プロピニル)-1-p-メトキシ安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 50 ml 溶液に 6.4% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 37.7 g を 0℃ にて 1 時間かけて滴下した。室温に昇温した後、一晚攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色粉末の目的物を 2.36 g 得た。

融点：144～155℃。

【0151】

実施例 8：N-〔3-〔2-メチルベンジル〕-5-イソオキサゾリル〕メチル-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号 IV-12）：

【化 38】



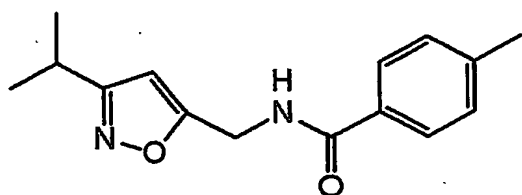
2-メチルペンジラルドキシム 7.75 g 及び N-(2-プロピニル)-1-p-メチル安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 70 ml 溶液に 4.4% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 87.9 g を 0℃ にて 30 分かけて滴下した。室温に昇温した後、2 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色油状の目的物を 2.12 g 得た。

NMR : δ 2.27(3H,s), 2.36(3H,s), 3.93(2H,s), 4.62(2H,d), 5.83(1H,s), 6.48-6.78(1H,brs), 7.13(4H,s), 7.20(2H,d), 7.67(2H,d)。

【0152】

実施例 9 : N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-5) :

【化 39】



イソプロピルアルドキシム 7.54 g 及び N-(2-プロピニル)-1-p-メチル安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 100 ml 溶液に 4.0% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 161.2 g を 0℃ にて 30 分かけて滴下した。室温に昇温した後、1 晩攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色油状の目的物を 0.56 g 得た。

融点 : 107 ~ 116℃ ;

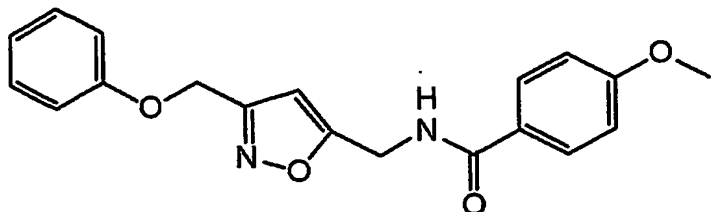
NMR : δ 1.25(6H,d), 2.38(3H,s), 2.78-3.24(1H,m), 4.69(2H,d), 6.08(1H,s), 6.85(1H,br), 7.21(2H,d), 7.71(2H,d)。

【0153】

実施例 10 : N-[(3-フェニルオキシメチル-5-イソオキサゾリル) メチル]

ル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-45) :

【化40】



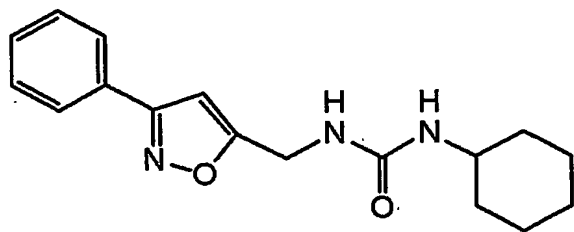
フェニルオキシメチルアルドキシム 5.99 g 及び N-(2-プロピニル)-1-p-メトキシ安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 50 ml 溶液に 4.5% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 65.6 g を 0℃ にて 30 分かけて滴下した。室温に昇温した後、1 晩した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色ペーストの目的物を 1.00 g 得た。

NMR : δ 3.82(3H,s), 4.72(2H,d), 5.12(2H,s), 6.34(1H,s), 6.41-6.65(1H,brs), 6.75-7.88(9H,m)。

【0154】

実施例 11 : 3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号II-7) :

【化41】



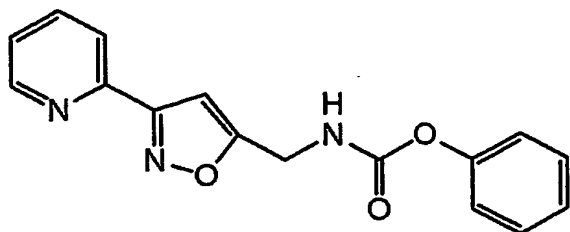
5-アミノメチル-3-フェニルイソキサゾール 1.00 g のエタノール 30 ml 溶液に、シクロヘキシルイソシアネート 0.79 g を室温にて加えた後、一晩攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮した後、析出した結晶を濾取し、イソプロピルエーテルにて洗浄し、下記物性を有する無色結晶の目的物を 1.65 g 得た。

融点 : 155 ~ 158℃。

【0155】

実施例12：{[3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号I-31）：

【化42】



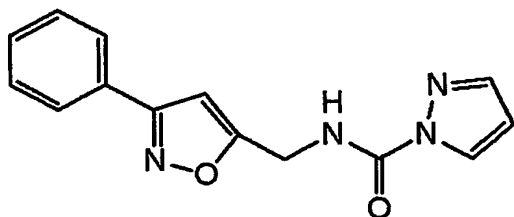
5-アミノメチル-3-(2-ピリジル)イソオキサゾール1.00gとジイソプロピルエチルアミン0.89gのジクロロメタン30mlの溶液にクロロギ酸フェニル0.89gを0℃にて加え、室温まで昇温した後1時間攪拌した。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.62g得た。

融点：104～107℃。

【0156】

実施例13：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-ピラゾリルアミドの製造（化合物番号III-192）：

【化43】



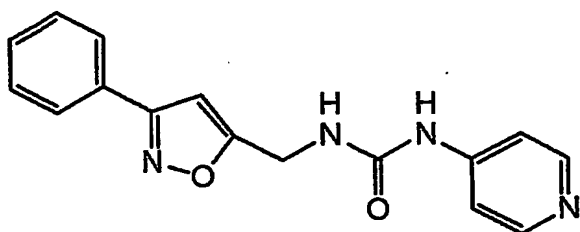
ピラゾール0.78gのテトラヒドロフラン30ml溶液にN,N'-カルボジリジイミダゾール0.93gを室温にて加え、1時間攪拌した。続いて、反応溶液に5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール1.00gを加えて一晩攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.51g得た。

融点：137～138℃。

【0157】

実施例14：3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-(4-ピリジル)尿素の製造(化合物番号II-101)：

【化44】



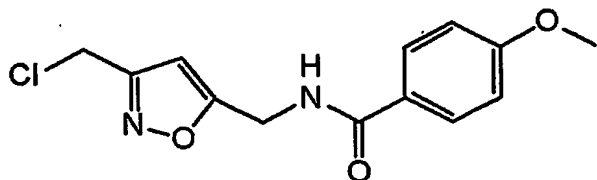
4-アミノピリジン0.65gのテトラヒドロフラン30ml溶液にN, N'-カルボジルジイミダゾール0.93gを室温にて加え、一晚攪拌した。続いて反応溶液に5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール1.0gを加えて一晚攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.62g得た。

融点：156～162℃。

【0158】

実施例15：N-[(3-クロルメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-3)：

【化45】



クロルメチルアルドキシム47.7g及びN-(2-プロピニル)-1-p-メトキシ安息香酸アミド6.43gのジクロロメタン150ml溶液に10%次亜塩素酸ナトリウム水溶液380gを0℃にて1時間かけて滴下した。室温に昇温した後、一晚攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色固体の目的物を5.83g

得た。

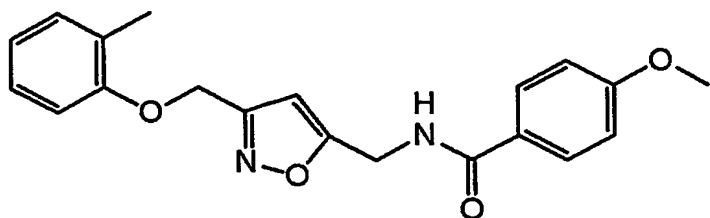
融点：93～110℃；

NMR： δ 3.86(3H,s), 4.53(2H,s), 4.72(2H,d), 6.31(1H,s), 6.69(1H,brs), 6.92(2H,d), 7.75(2H,d)。

【0159】

実施例16：N-〔〔3-（2-メチルフェニル）オキシメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-47）：

【化46】



N-〔〔3-クロルメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミド1.20g及び2-メチルフェノール1.85gのジメチルホルムアミド30ml溶液に炭酸カリウム0.89gを室温にて加えた。100℃に昇温し、5時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出し、集めた有機層を水及び飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色固体の目的物を0.65g得た。

融点：115～117℃；

NMR： δ 2.20(3H,s), 3.80(3H,s), 4.68(2H,d), 5.08(2H,s), 6.30(1H,s), 6.61-7.82(9H,m)。

【0160】

実施例17

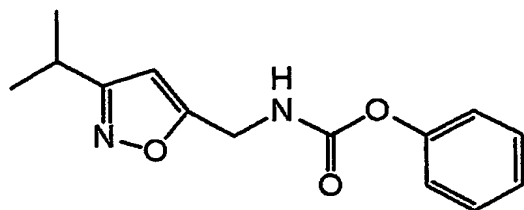
実施例1～16に記載の方法により、以下に示す実施例17（1）～17（15）に示す化合物を得た。

【0161】

実施例17（1）：〔〔3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕カ

ルバミン酸フェニルの製造（化合物番号 I-4）：

【化 47】



性状：油状，

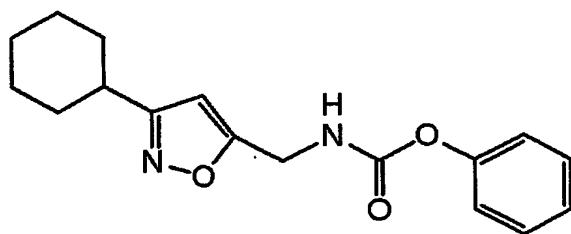
NMR： δ 1.28(6H, d), 2.75-3.29(1H, m), 4.52(2H, d), 5.34-5.72(1H, brs), 6.12(1H, s), 7.00-7.48(5H, m)。

【0162】

実施例 17 (2)：〔(3-シクロヘキシル-5-イソオキサゾリル)メチル]

カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号 I-6）：

【化 48】



性状：ペースト，

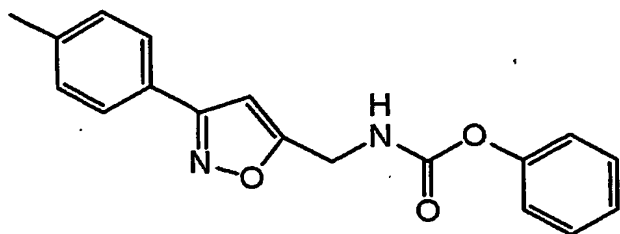
NMR： δ 1.08-2.10(10H, m), 2.48-2.91(1H, brs), 4.42(2H, d), 5.80-6.00(1H, brs), 6.02(1H, s), 6.98-7.48(5H, m)。

【0163】

実施例 17 (3)：{〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}

カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号 I-25）：

【化 49】

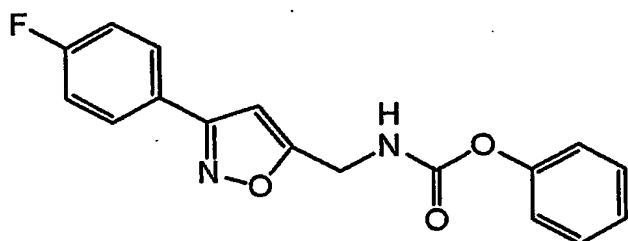


融点：119～123℃。

【0164】

実施例 17 (4)：{ [3-(4-フルオロフェニル)-5-イソオキサゾリル] メチル} カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-27)：

【化 50】

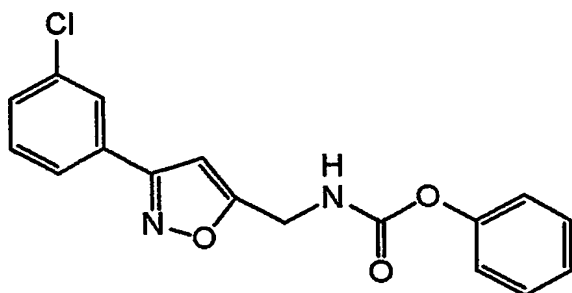


融点：114～116℃。

【0165】

実施例 17 (5)：{ [3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル] メチル} カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-29)：

【化 51】



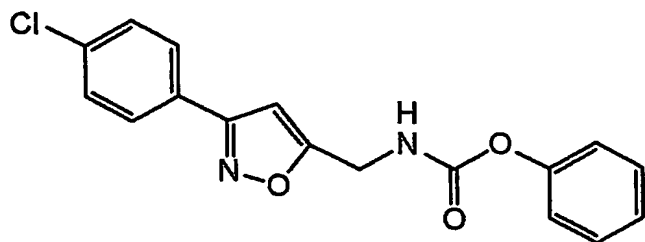
融点：103～105℃。

【0166】

実施例 17 (6)：{ [3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル]

メチル} カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-30) :

【化 5 2】

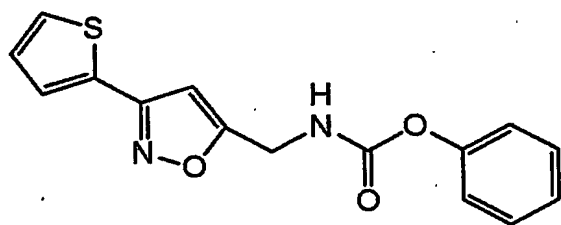


融点: 135~137℃。

【0167】

実施例 17 (7) : { [3-(2-チエニル)-5-イソオキサゾリル] メチル }
カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-32) :

【化 5 3】

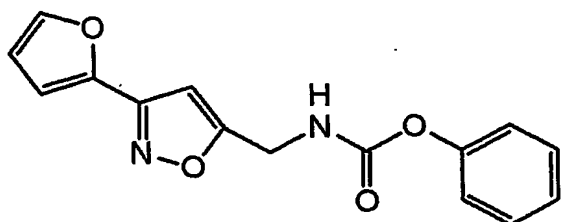


融点: 104~107℃。

【0168】

実施例 17 (8) : { [3-(2-フリル)-5-イソオキサゾリル] メチル }
カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-33) :

【化 5 4】

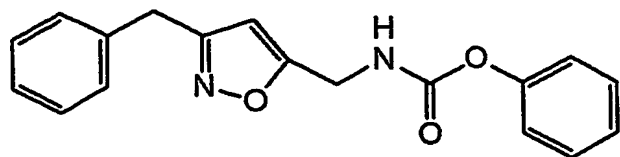


融点: 89~92℃。

【0169】

実施例 17 (9) : [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] カルバ
ミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-38) :

【化 5 5】

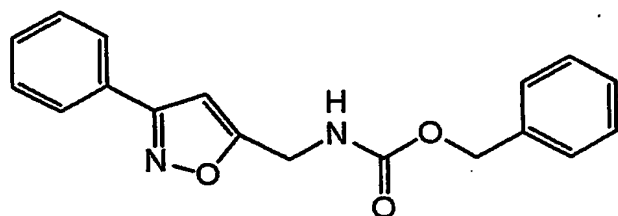


融点：135～137℃。

【0170】

実施例 17 (10)：[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]カルバミン酸ベンジルの製造（化合物番号 I-41）：

【化 5 6】

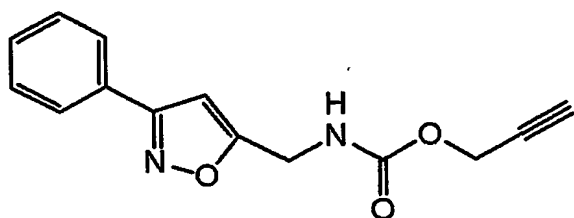


融点：104～105℃。

【0171】

実施例 17 (1.1)：[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]カルバミン酸 2-プロピニルの製造（化合物番号 I-42）：

【化 5 7】

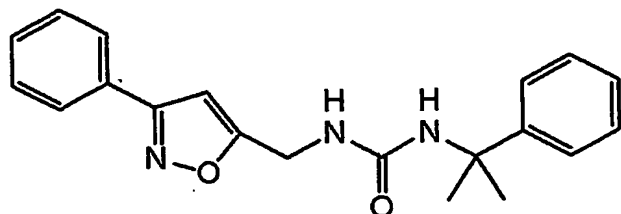


融点：102～104℃。

【0172】

実施例 17 (12)：3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素の製造（化合物番号 I-45）：

【化 58】

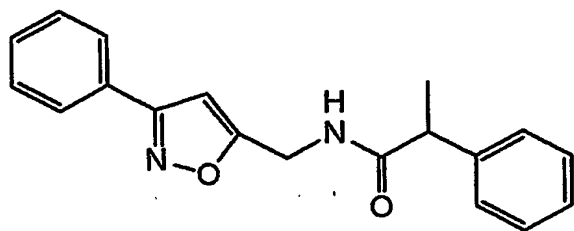


融点：160～164℃。

【0173】

実施例 17 (13)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]
2-フェニルプロパン酸アミドの製造（化合物番号 I-46）：

【化 59】

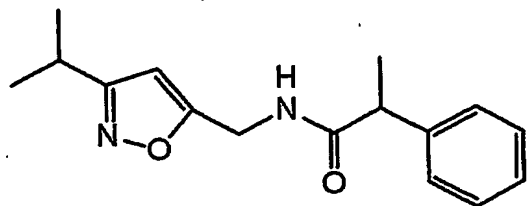


融点：110～112℃。

【0174】

実施例 17 (14)：N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]
-2-フェニルプロパン酸アミドの製造（化合物番号 I-47）：

【化 60】



性状：油状，

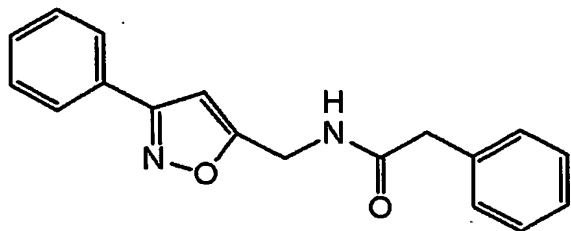
NMR： δ 0.80-1.66(9H, m), 2.67-3.14(1H, m), 3.27-3.81(1H, m), 4.40(2H, d), 5.80(1H, s), 6.22-6.51(1H, br), 7.26(5H, s)。

【0175】

実施例 17 (15)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]

2-フェニルエタン酸アミドの製造（化合物番号 I-48）：

【化 61】



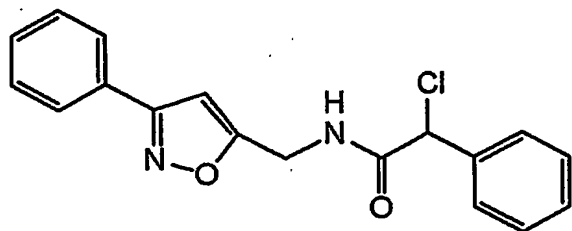
融点：153～154℃。

【0176】

実施例 17（16）：N-〔（3-フェニル-5-イソオキサゾリル）メチル〕

2-クロル-2-フェニルエタン酸アミドの製造（化合物番号 I-49）：

【化 62】

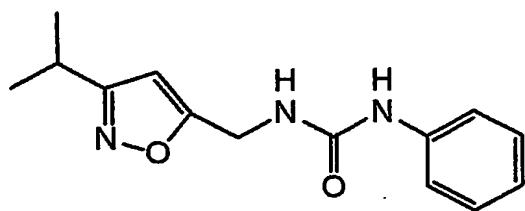


融点：121～125℃。

【0177】

実施例 17（17）：1-〔（3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル）メチル〕-3-フェニル尿素の製造（化合物番号 II-3）：

【化 63】



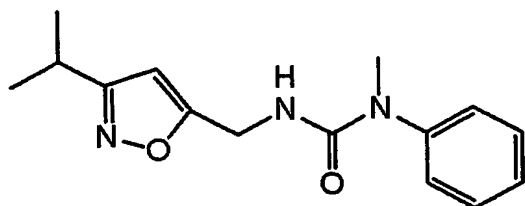
性状：ペースト，

NMR： δ 1.08(6H, d), 2.69-3.14(1H, m), 4.33(2H, d), 5.98(1H, s), 6.22-6.44(1H, brs), 6.86-7.31(5H, m), 7.92(1H, d)。

【0178】

実施例17(18) : 1-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-フェニル-3-メチル尿素の製造(化合物番号II-4) :

【化64】



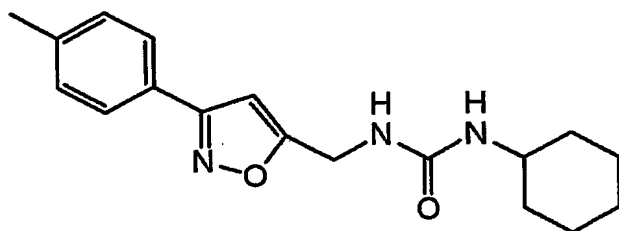
性状 : 油状,

NMR : δ 1.24(6H, d), 2.72-3.21(1H, m), 4.42(2H, d), 4.77-5.04(1H, brs), 5.99(1H, s), 7.10-7.52(5H, m)。

【0179】

実施例17(19) : 1-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-3-シクロヘキシル尿素の製造(化合物番号II-9) :

【化65】

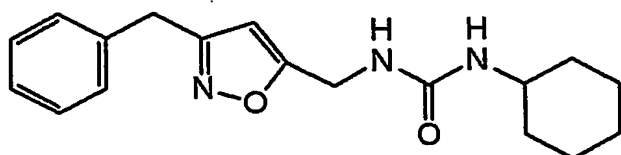


融点 : 163~170℃。

【0180】

実施例17(20) : 1-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-シクロヘキシル尿素の製造(化合物番号II-13) :

【化66】



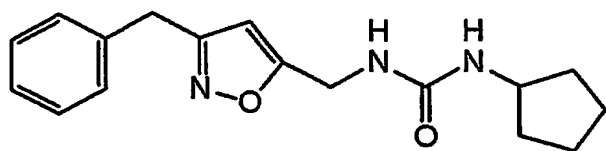
性状 : 油状,

NMR : δ 0.80-2.05(10H, m), 3.22-3.68(1H, brs), 3.92(2H, s), 4.35(2H, d), 5.23(1H, brt), 7.20(5H, brs)。

【 0 1 8 1 】

実施例 1 7 (2 1) : 1 - [(3 - ペンジル - 5 - イソオキサゾリル) メチル]
- 3 - シクロペンチル尿素の製造 (化合物番号 II - 1 4) :

【 化 6 7 】

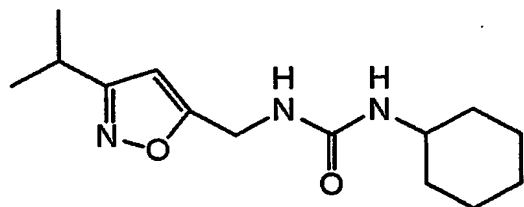


融点 : 1 2 5 ~ 1 2 9 °C。

【 0 1 8 2 】

実施例 1 7 (2 2) : 1 - [(3 - イソプロピル - 5 - イソオキサゾリル) メチル]
- 3 - シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II - 1 5) :

【 化 6 8 】



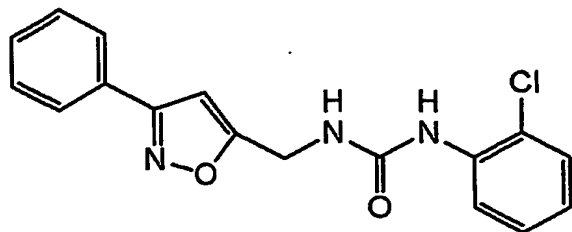
性状 : 油状,

NMR : δ 0.48-2.08(16H, m), 3.28-3.63(2H, m), 4.35-4.60(1H, brs), 4.43(2H, d), 4.90(1H, Brt), 6.12(1H, s)。

【 0 1 8 3 】

実施例 1 7 (2 3) : 1 - [(3 - フェニル - 5 - イソオキサゾリル) メチル]
- 3 - (2 - クロルフェニル) 尿素の製造 (化合物番号 II - 4 8) :

【化 69】

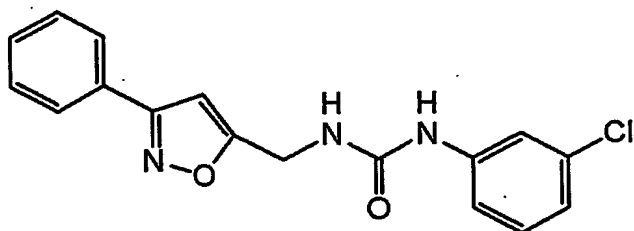


融点：166～169℃。

【0184】

実施例 17 (24)：1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]
-3-(3-クロルフェニル)尿素の製造 (化合物番号II-49)：

【化 70】

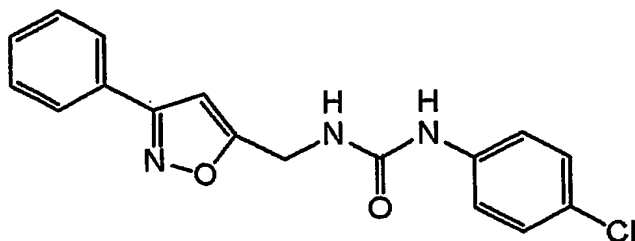


NMR： δ 4.58(2H, d) 6.51(1H, s) 6.82-7.86(10H, m) 8.08(1H, brs)。

【0185】

実施例 17 (25)：1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]
-3-(4-クロルフェニル)尿素の製造 (化合物番号II-50)：

【化 71】



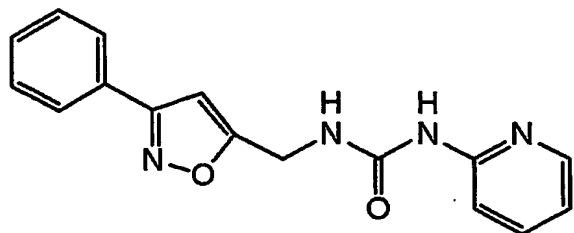
融点：212～219℃。

【0186】

実施例 17 (26)：1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]

－ 3 － （ 2－ピリジル） 尿素の製造（化合物番号II－ 99）：

【化 7 2】



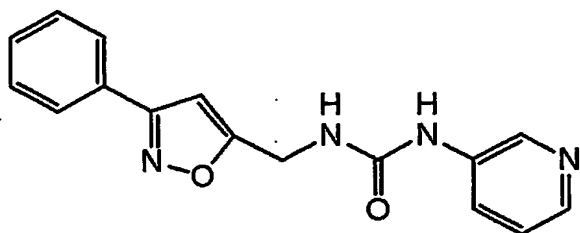
融点：211～212℃。

【0187】

実施例 17（27）：1－〔（3－フェニル－5－イソオキサゾリル）メチル〕

－ 3 － （ 3－ピリジル） 尿素の製造（化合物番号II－ 100）：

【化 7 3】



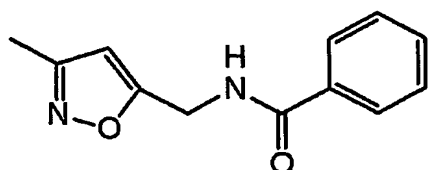
融点：186～188℃。

【0188】

実施例 17（28）：N－〔（3－メチル－5－イソオキサゾリル）メチル〕 安

息香酸アミドの製造（化合物番号III－ 1）：

【化 7 4】

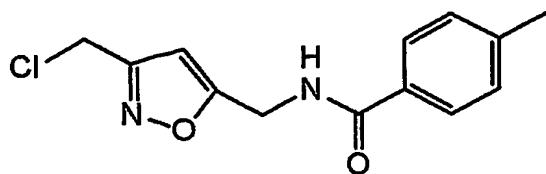


融点：106～107℃。

【0189】

実施例 17（29）：N－〔（3－クロルメチル－5－イソオキサゾリル）メチル〕 安
息香酸アミドの製造（化合物番号III－ 2）：

【化 75】



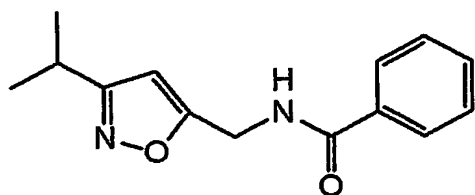
性状：ペースト，

NMR： δ 2.39(3H, s), 4.53(2H, s), 4.72(2H, d), 6.32(1H, s), 6.63-6.92(1H, brs), 7.21(2H, d), 7.68(2H, d)。

【0190】

実施例 17 (30)：N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造(化合物番号III-4)：

【化 76】



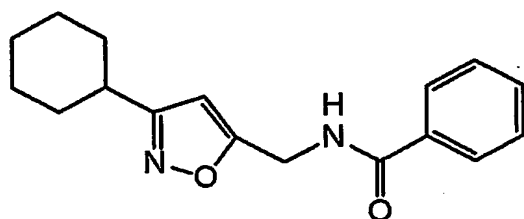
性状：油状，

NMR： δ 1.25(6H, d), 2.80-3.27(1H, m), 4.71(2H, d), 6.09(1H, s), 6.66(1H, brs), 7.28-7.88(5H, m)。

【0191】

実施例 17 (31)：N-[(3-シクロヘキシル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造(化合物番号III-6)：

【化 77】



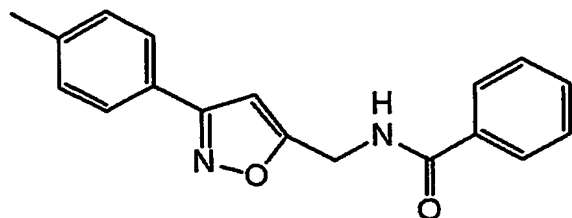
融点：89～93℃。

【0192】

実施例 17 (32)：N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}

チル) 安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-10) :

【化78】

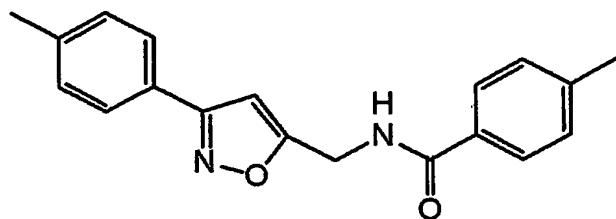


融点: 154~156℃。

【0193】

実施例17(33): N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-11) :

【化79】

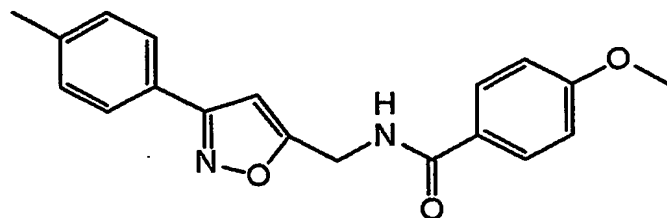


融点: 164~166℃。

【0194】

実施例17(34): N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-12) :

【化80】

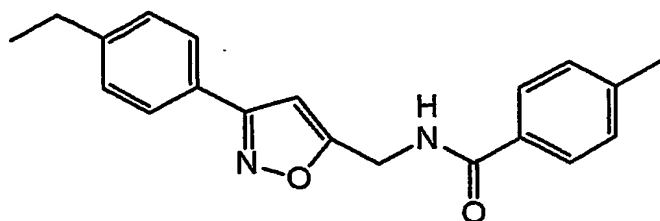


融点: 174~175℃。

【0195】

実施例17(35): N-{[3-(4-エチルフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-13) :

【化 8 1】

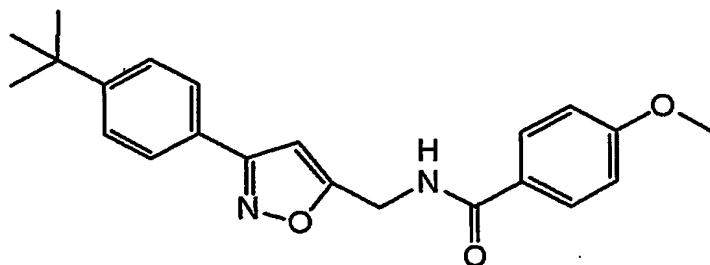


融点：150～152℃。

【0196】

実施例 17 (36) : N- { [3- (4-*t*-ブチルフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-14) :

【化 8 2】

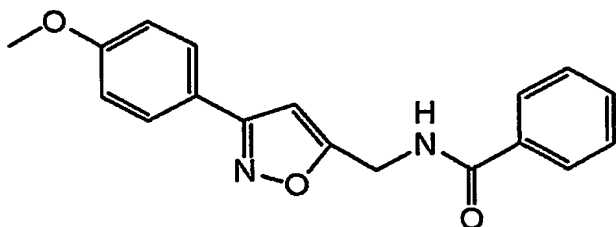


融点：179～180℃。

【0197】

実施例 17 (37) : N- { [3- (4-メトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-17) :

【化 8 3】



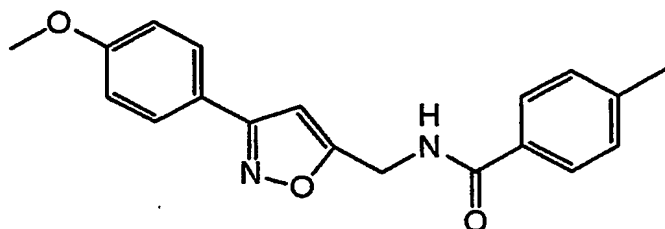
融点：125～127℃。

【0198】

実施例 17 (38) : N- { [3- (4-メトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-19)

:

【化 84】



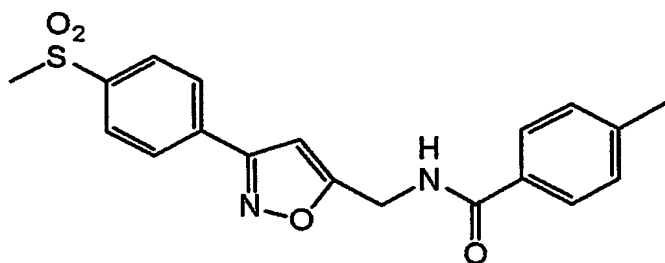
融点：139～142℃；

NMR： δ 2.37(3H, s), 3.81(3H, s), 4.75(2H, d), 6.43(1H, s), 6.69(1H, brs), 6.82-7.83(8H, m)。

【0199】

実施例17(39)：N-{[3-(4-メシルフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-26)：

【化 85】

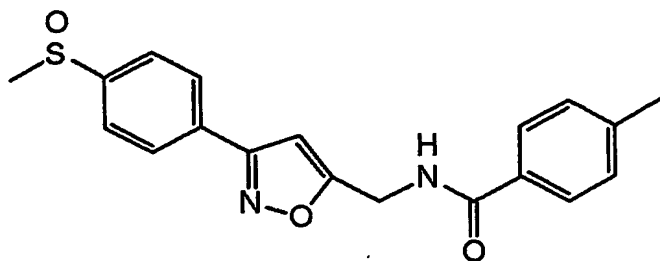


NMR： δ 2.37(3H, s), 3.08(3H, s), 4.78(2H, d), 6.61(1H, s), 7.09-8.08(9H, m)。

【0200】

実施例17(40)：N-{[3-(4-メタンスルフィニルフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号II-27)：

【化 86】

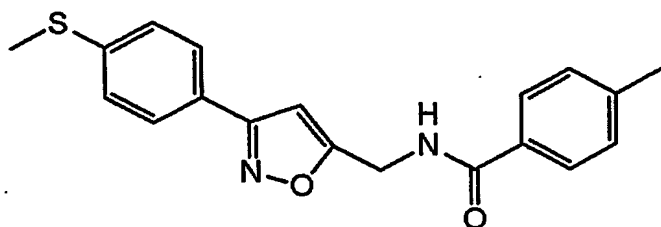


NMR : δ 2.37(3H, s), 2.72(3H, s), 4.78(2H, d), 5.99(1H, s), 7.09-8.08(9H, m)。

【0201】

実施例 17 (41) : N- { [3- (4-メチルチオフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-28) :

【化 87】

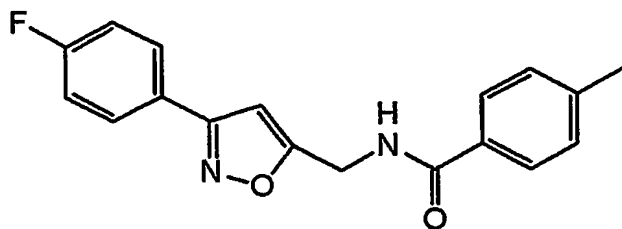


融点 : 135 ~ 155℃。

【0202】

実施例 17 (42) : N- { [3- (4-フルオロフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-31) :

【化 88】



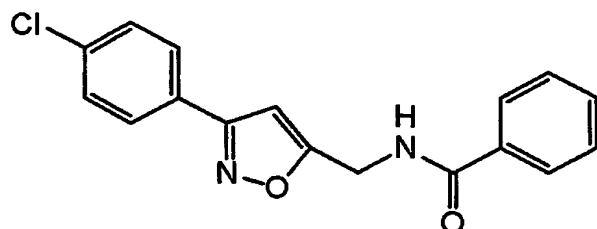
融点 : 167 ~ 168℃ ;

NMR : δ 2.67(3H, s), 4.78(2H, d), 6.50(1H, s), 6.60-7.93(9H, m)。

【0203】

実施例17(43) : N- { [3- (4-クロルフェニル) -5-イソオキサゾ
リル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-34) :

【化89】

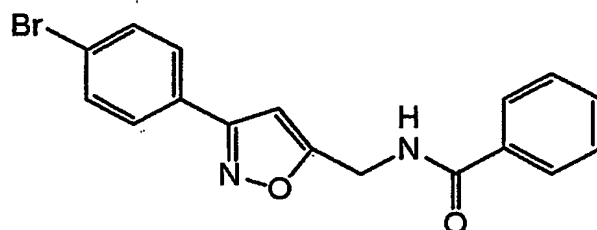


融点 : 172 ~ 173℃。

【0204】

実施例17(44) : N- { [3- (4-ブロモフェニル) -5-イソオキサゾ
リル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-37) :

【化90】

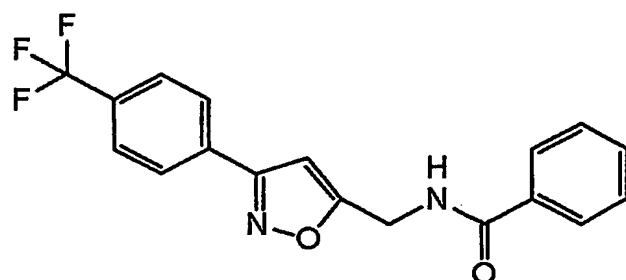


融点 : 184 ~ 187℃。

【0205】

実施例17(45) : N- { [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -5-
イソオキサゾリル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-40) :

【化91】

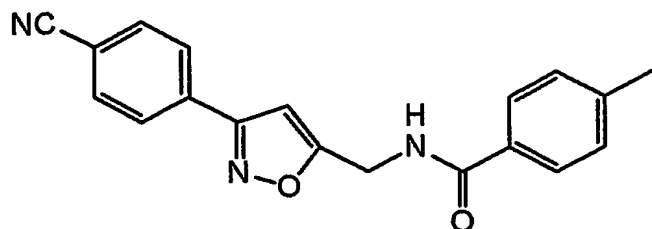


融点 : 179 ~ 180℃。

【0206】

実施例 17 (46) : N- { [3- (4-シアノフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-43) :

【化 9 2】

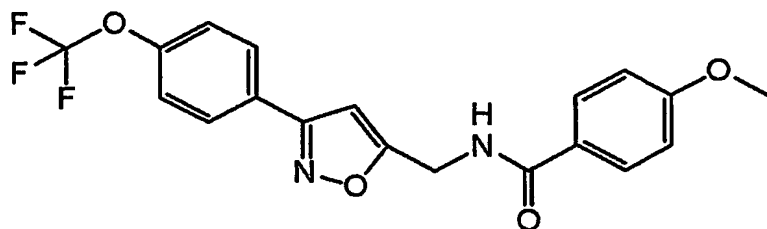


NMR : δ 2.33(3H, s), 4.79(2H, d), 6.44-6.85(1H, br), 6.59(1H, s), 7.10-8.87(8H, m)。

【0207】

実施例 17 (47) : N- { [3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-49) :

【化 9 3】

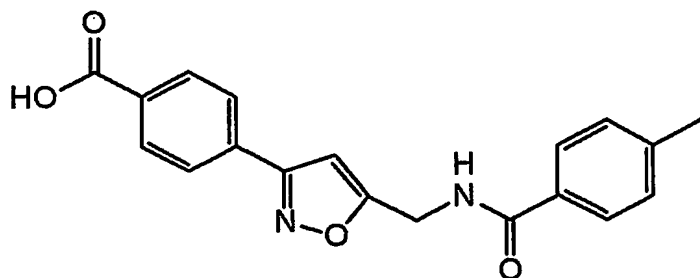


融点 : 188 ~ 191℃。

【0208】

実施例 17 (48) : N- { [3- (4-カルボキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-51) :

【化 9 4】

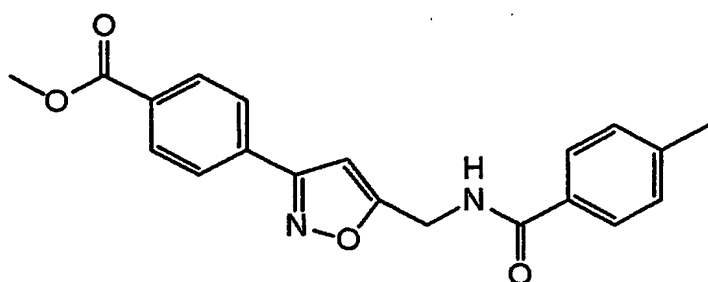


融点：248℃以上（分解）。

【0209】

実施例17（49）：N- { [3-（4-メトキシカルボニルフェニル）-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号II I-52）：

【化95】



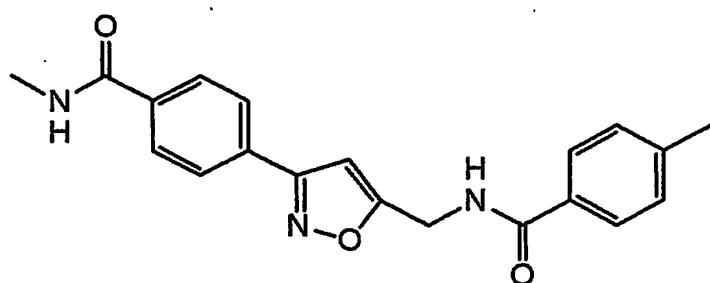
融点：173～175℃；

NMR： δ 2.34(3H, s), 3.92(3H, d), 4.76(2H, d), 6.53(1H, s), 6.92-8.15 (9H, m)。

【0210】

実施例17（50）：N- { [3-（4-メチルアミノカルボニルフェニル）-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号III-54）：

【化96】

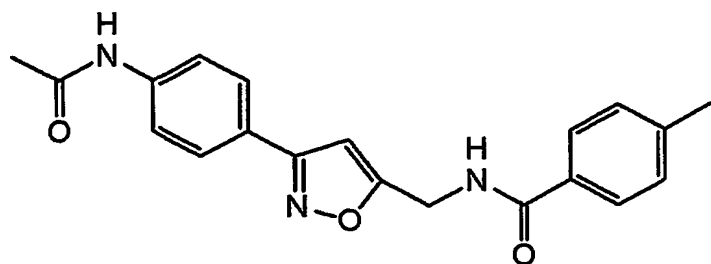


融点：261～262℃。

【0211】

実施例17（51）：N- { [3-（4-アセトアミドフェニル）-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号III-57）：

【化97】

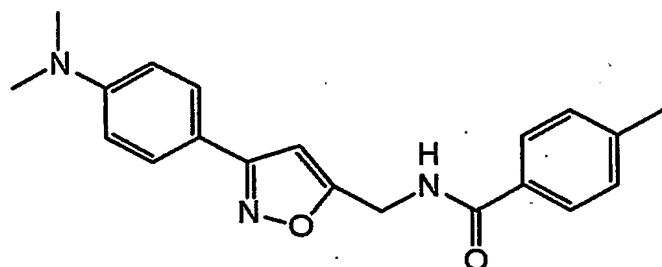


融点：>200℃。

【0212】

実施例17(52)：N-([3-(4-ジメチルアミノフェニル)-5-イソキサゾリル]メチル)-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-61)：

【化98】

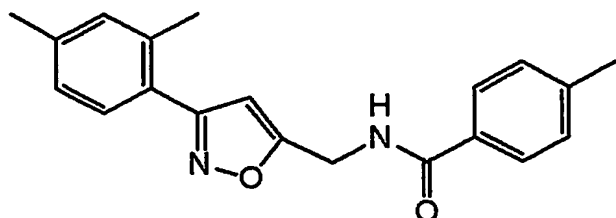


NMR： δ 2.33(3H, s), 2.99(6H, s), 4.74(2H, d), 6.46(1H, s), 6.53-8.07(9H, m)。

【0213】

実施例17(53)：N-([3-(2,4-ジメチルフェニル)-5-イソキサゾリル]メチル)-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-65)：

【化99】

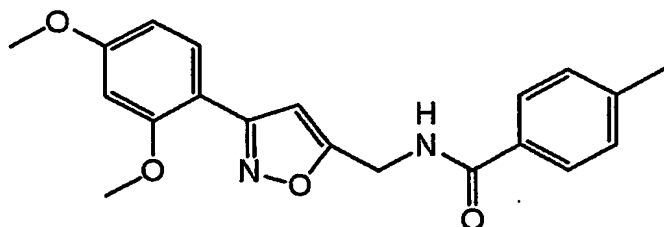


融点：138~140℃。

【0214】

実施例17(54) : N- { [3- (2, 4-ジメトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-66) :

【化100】

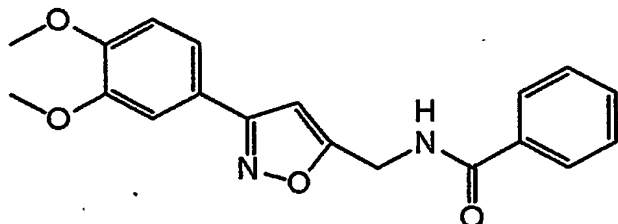


融点 : 157 ~ 158℃。

【0215】

実施例17(55) : N- { [3- (3, 4-ジメトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-67) :

【化101】

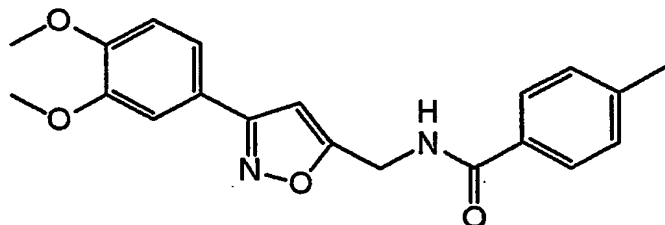


融点 : 122 ~ 130℃。

【0216】

実施例17(56) : N- { [3- (3, 4-ジメトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-68) :

【化102】



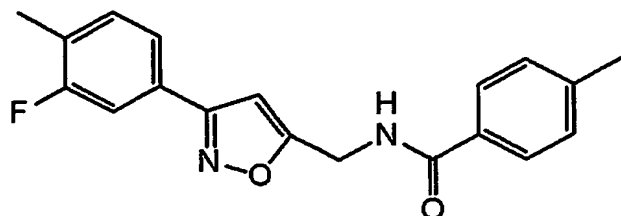
融点 : 160 ~ 162℃ ;

NMR : δ 2.32(3H, s), 3.82(6H, s), 4.72(2H, d), 6.43(1H, s), 6.72-7.83 (8H, m)。

【0217】

実施例17(57) : N- { [3- (3-フルオロ-4-メチルフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-73) :

【化103】

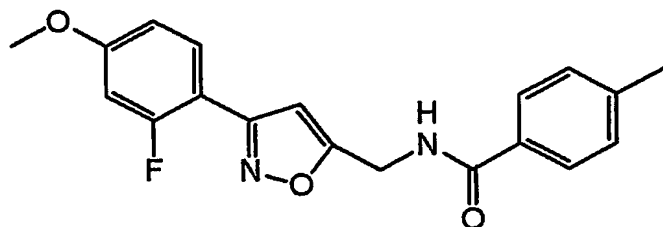


融点 : 165 ~ 166℃。

【0218】

実施例17(58) : N- { [3- (2-フルオロ-4-メトキシフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-74) :

【化104】

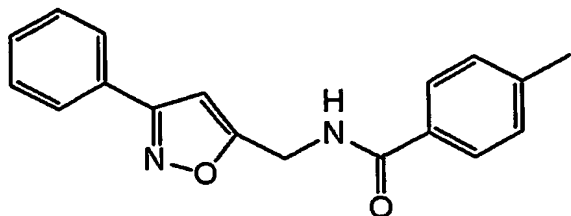


融点 : 154 ~ 155℃。

【0219】

実施例17(59) : N- [(3-フェニル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-107) :

【化105】

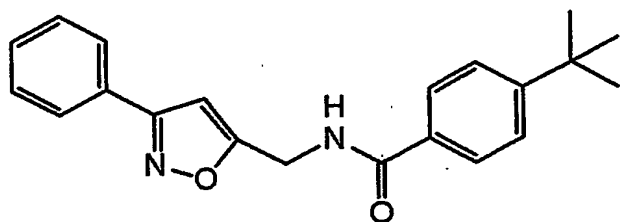


融点：154～156℃。

【0220】

実施例17(60)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-tert-ブチル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-108)：

【化106】

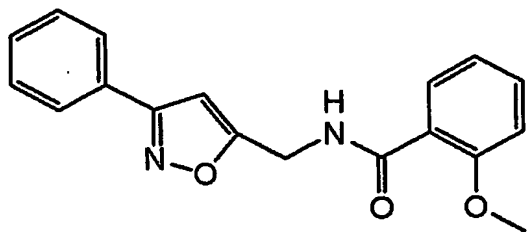


融点：135～140℃。

【0221】

実施例17(61)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-109)：

【化107】



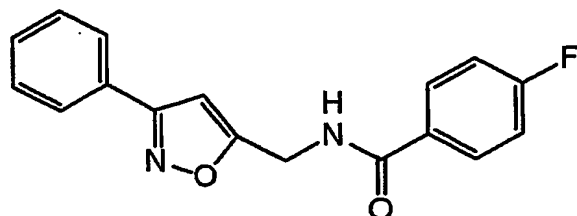
性状：油状，

NMR： δ 4.00(3H, s) 4.81(2H, d) 6.53(1H, s) 6.87-8.55(10H, m)。

【0222】

実施例17(62)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-フルオロ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-121)：

【化108】

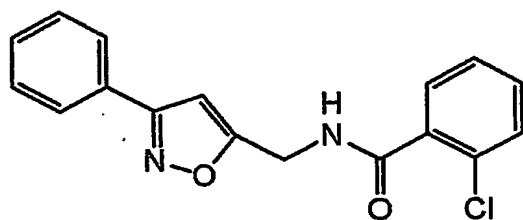


融点：126～131℃。

【0223】

実施例17(63)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-クロル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-122)：

【化109】

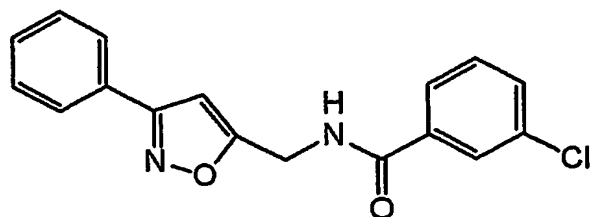


融点：170～175℃。

【0224】

実施例17(64)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-クロル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-123)：

【化110】

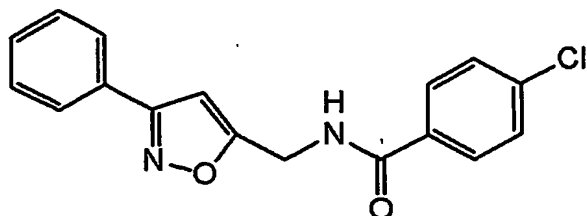


融点：113～115℃。

【0225】

実施例17(65)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-124)：

【化 1 1 1】

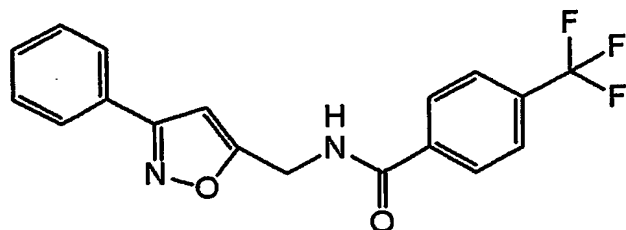


融点：148～151℃。

【0 2 2 6】

実施例 17 (66) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-トリフルオロメチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-130) :

【化 1 1 2】

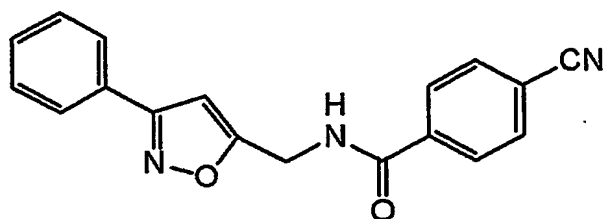


融点：157～168℃。

【0 2 2 7】

実施例 17 (67) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-シアノ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-133) :

【化 1 1 3】

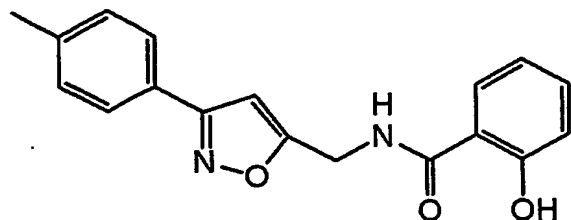


融点：144～145℃。

【0 2 2 8】

実施例 17 (68) : N-[(3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-ヒドロキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-134) :

【化 114】

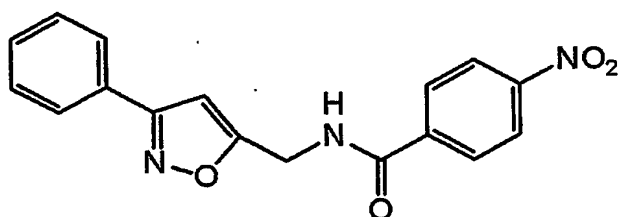


融点：120～132℃。

【0229】

実施例 17 (69)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-ニトロ安息香酸アミドの製造（化合物番号III-137）：

【化 115】

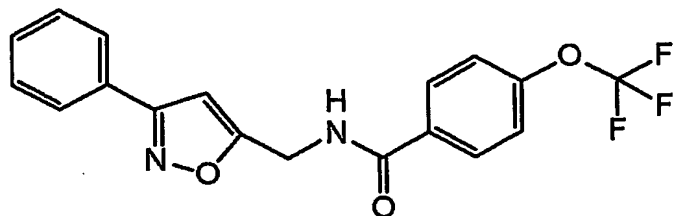


融点：166～174℃。

【0230】

実施例 17 (70)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-トリフルオロメトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号III-139）：

【化 116】

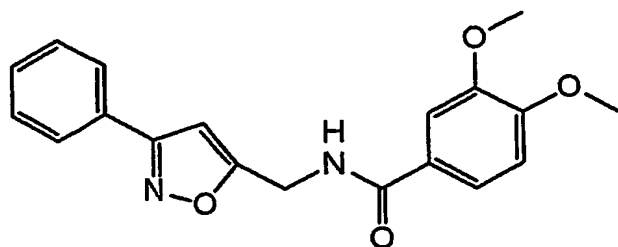


融点：140～141℃。

【0231】

実施例 17 (71)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3,4-ジメトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号III-156）：

【化117】

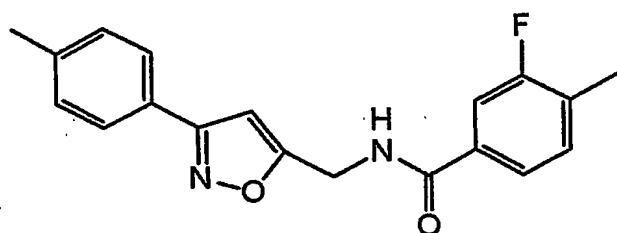


融点：157～169℃。

【0232】

実施例17(72)：N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-3-フルオロ-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号III-162）：

【化118】

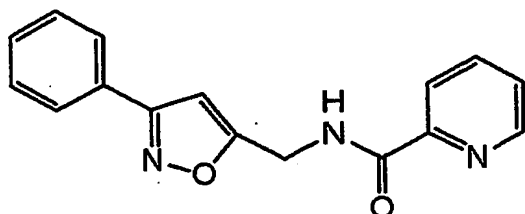


融点：148～154℃。

【0233】

実施例17(73)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-2-ピリジンの製造（化合物番号III-174）：

【化119】

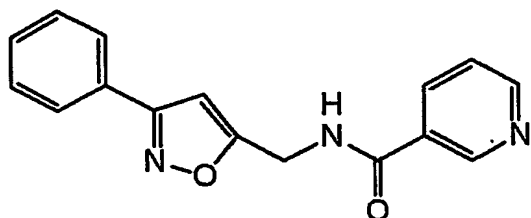


融点：125～127℃。

【0234】

実施例17(74)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-3-ピリジンの製造（化合物番号III-175）：

【化120】

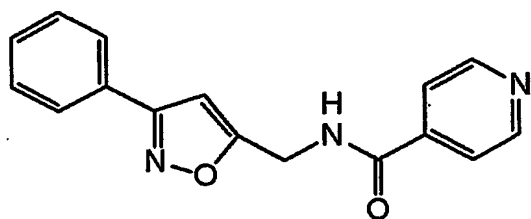


融点：130～132℃。

【0235】

実施例17(75)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-4-ピリジンの製造(化合物番号III-176)：

【化121】

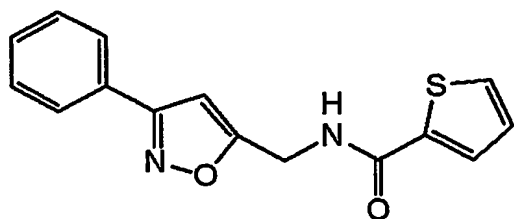


融点：125～135℃。

【0236】

実施例17(76)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-2-チオフェンの製造(化合物番号III-177)：

【化122】



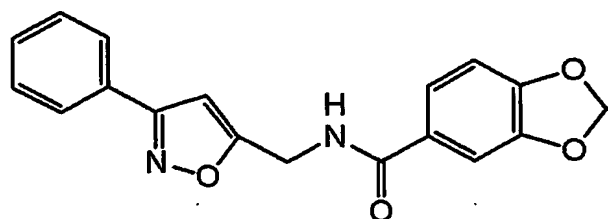
融点：141～155℃。

【0237】

実施例17(77)：5-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-1,3-ベンゾジオキソールの製造(化合物番号III-180)

：

【化123】

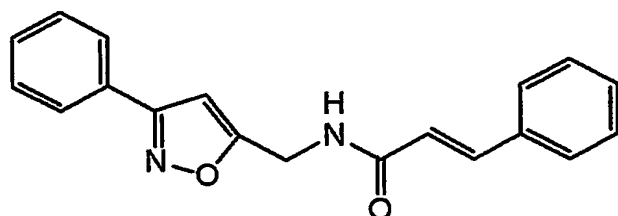


融点：175～183℃。

【0238】

実施例17(78)：(E)-N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-フェニルプロパン酸アミドの製造(化合物番号III-201)：

【化124】

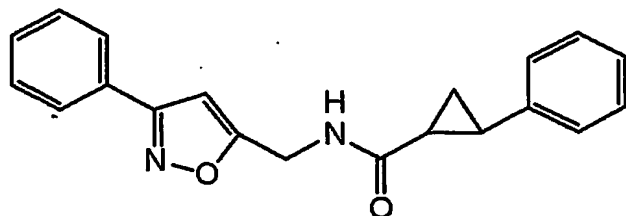


融点：155～157℃。

【0239】

実施例17(79)：1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル]-2-フェニルシクロプロパンの製造(化合物番号III-202)：

【化125】

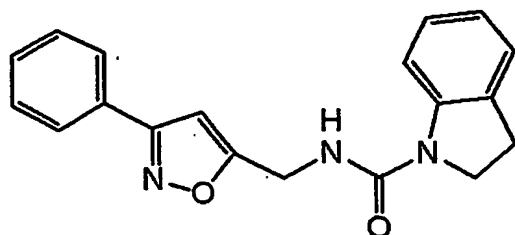


融点：152～154℃。

【0240】

実施例17(80)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル]インドリンの製造(化合物番号III-208)：

【化126】

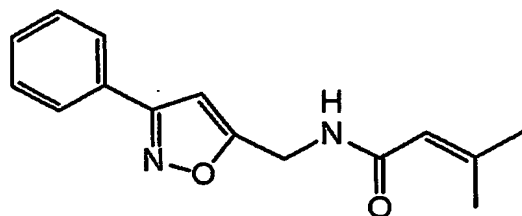


融点：137～139℃。

【0241】

実施例17(81)：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-メチル-2-ブテン酸アミドの製造(化合物番号III-209)：

【化127】

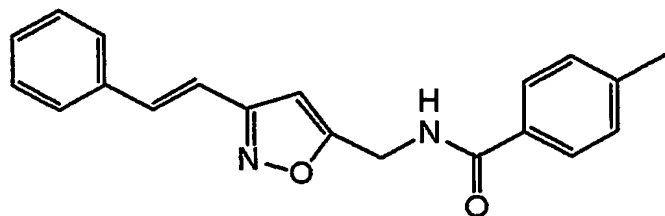


融点：97～98℃。

【0242】

実施例17(82)：N-{[3-(2-フェニルエテニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号III-210)：

【化128】



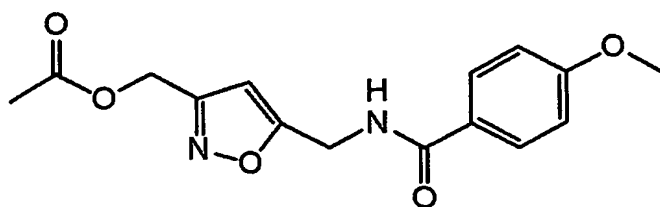
融点：151～156℃。

【0243】

実施例17(83)：N-[(3-アセチルオキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-2

11) :

【化129】



性状：ペースト，

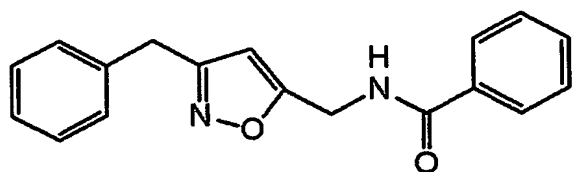
NMR : δ 2.09(3H, s), 3.80(3H, s), 4.68(2H, d), 5.09(2H, d), 6.21(1H, s), 6.87(2H, d), 7.19-7.40(1H, brt), 7.78(2H, d)。

【0244】

実施例17(84) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]

安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-1) :

【化130】



性状：油状，

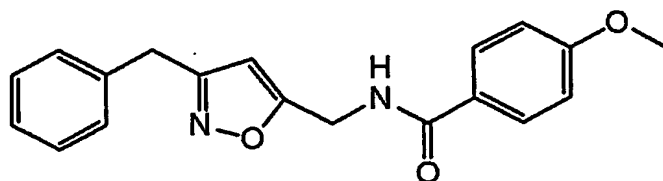
NMR : δ 3.92(2H, s), 4.61(2H, d), 5.94(1H, s), 6.83-7.88(11H, m)。

【0245】

実施例17(85) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]

-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-2) :

【化131】



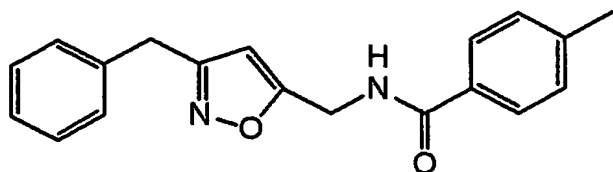
性状：油状，

NMR : δ 3.80(3H, s), 3.93(2H, s), 4.61(2H, d), 5.98(1H, s), 6.86(2H, d), 7.21(5H, s), 7.73(2H, d)。

【0246】

実施例17(86) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-3) :

【化132】

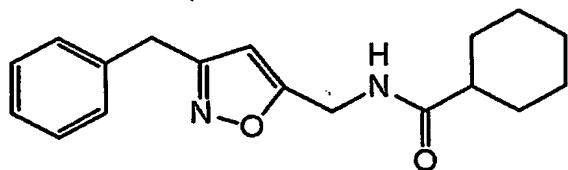


融点 : 119 ~ 124 °C。

【0247】

実施例17(87) : (3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニルシクロヘキサンの製造(化合物番号IV-4) :

【化133】



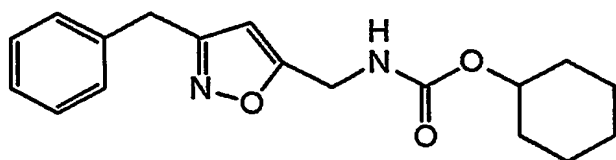
性状 : 油状,

NMR : δ 1.06-2.30(11H, m), 3.99(2H, s), 4.50(2H, d), 5.71-6.04(1H, br), 5.89(1H, s), 7.21(5H, s)。

【0248】

実施例17(88) : [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]カルバミン酸シクロヘキシルの製造(化合物番号IV-5) :

【化134】

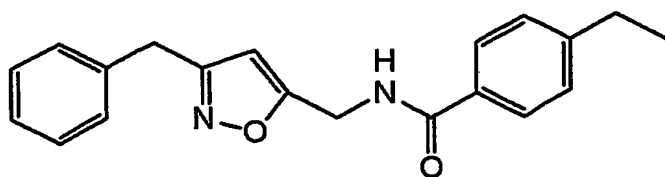


融点 : 98 ~ 104 °C。

【0249】

実施例17(89) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-エチル安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-6) :

【化135】



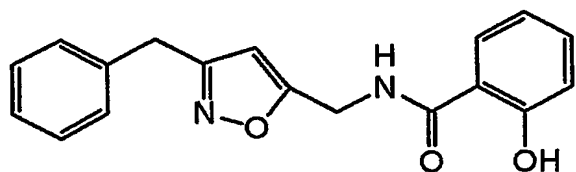
性状：油状，

NMR： δ 1.22(3H, t), 2.70(2H, q), 3.93(2H, s), 4.67(2H, d), 5.99(1H, s), 6.40-6.72(1H, brs), 7.08-7.47(7H, m), 7.69(2H, d)。

【0250】

実施例17(90)：N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-ヒドロキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-7)：

【化136】



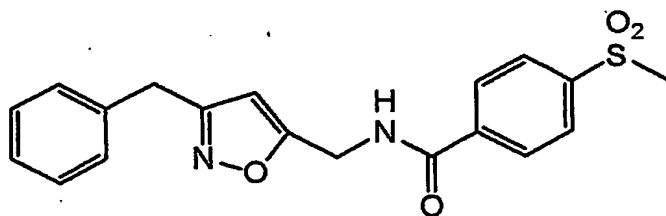
性状：ペースト，

NMR： δ 3.92(2H, s), 4.60(2H, d), 5.99(1H, s), 6.47-7.56(10H, m), 11.4(1H, s)。

【0251】

実施例17(91)：N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メシル安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-8)：

【化137】



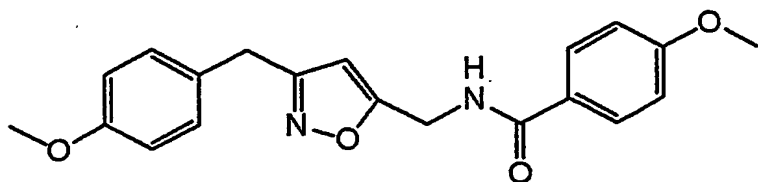
融点：148～157℃；

NMR： δ 3.04(3H, s), 3.97(2H, s), 4.69(2H, d), 6.01(1H, s), 6.95-7.55(6H, m), 7.93(4H, s)。

【0252】

実施例 17 (92) : N- { [3- (4-メトキシベンジル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-9) :

【化 138】

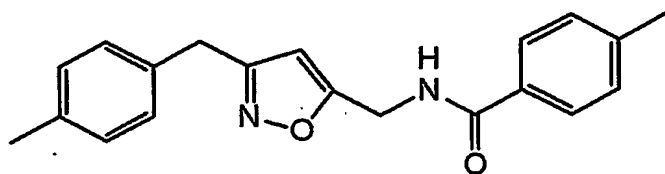


融点 : 114 ~ 117℃。

【0253】

実施例 17 (93) : N- { [3- (4-メチルベンジル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-10) :

【化 139】

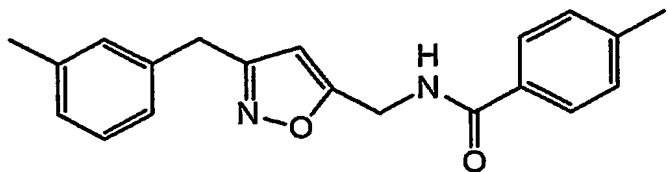


融点 : 86 ~ 97℃。

【0254】

実施例 17 (94) : N- { [3- (3-メチルベンジル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-11) :

【化 140】



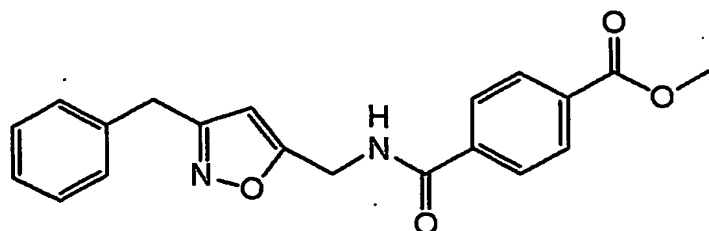
性状 : 油状,

NMR : δ 2.31(3H, s), 2.40(3H, s), 3.92(2H, s), 4.65(2H, d), 5.99(1H, s), 6.53-6.87(1H, brs), 6.87-7.86(8H, m)。

【0255】

実施例 17 (95) : N- [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシカルボニル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-23) :

【化141】

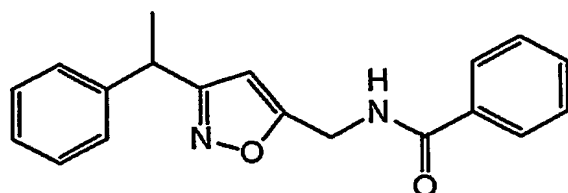


融点：134～140℃。

【0256】

実施例17(96)：N-〔3-(1-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-29)：

【化142】

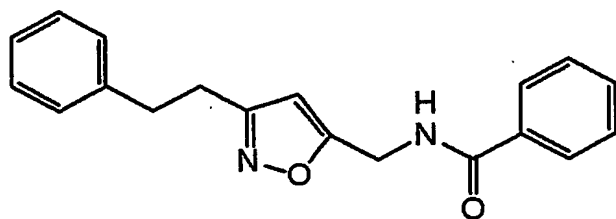


融点：100～107℃。

【0257】

実施例17(97)：N-〔3-(2-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-33)：

【化143】

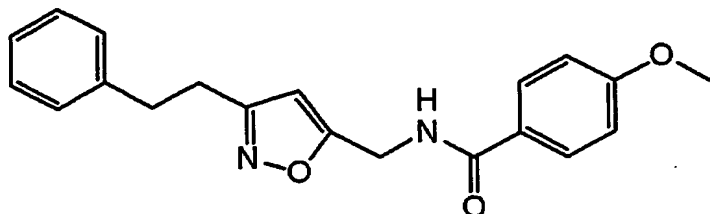


融点：53～83℃。

【0258】

実施例17(98)：N-〔3-(2-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-34)：

【化144】

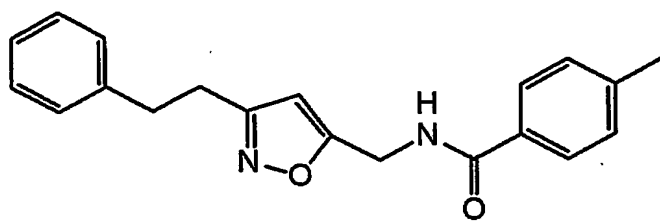


融点：119～131℃。

【0259】

実施例17(99)：N-〔〔3-(2-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-35）：

【化145】

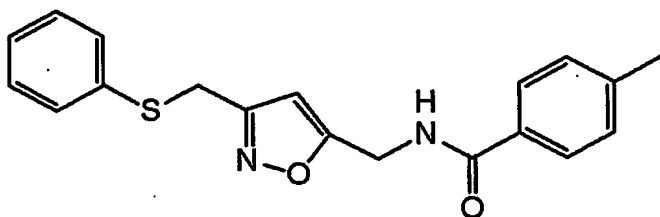


融点：131～137℃。

【0260】

実施例17(100)：N-〔〔3-フェニルチオメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-40）：

【化146】



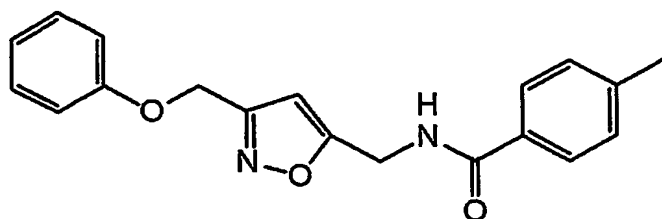
融点：79～85℃；

NMR： δ 2.40(3H, s), 4.04(2H, s), 4.62(2H, d), 6.13(1H, s), 6.76(1H, s), 7.03-7.74(10H, m)。

【0261】

実施例17(101)：N-〔〔3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-46）：

【化147】



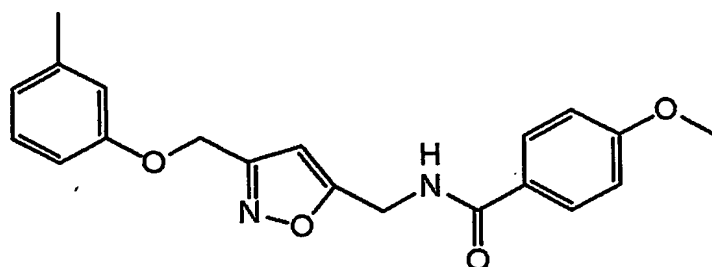
性状：ペースト，

NMR： δ 2.36(3H, s), 4.67(2H, d), 5.07(2H, s), 6.30(1H, s), 6.52-7.78 (10H, m)。

【0262】

実施例17(102)：N-{[3-(3-メチルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-48)：

【化148】



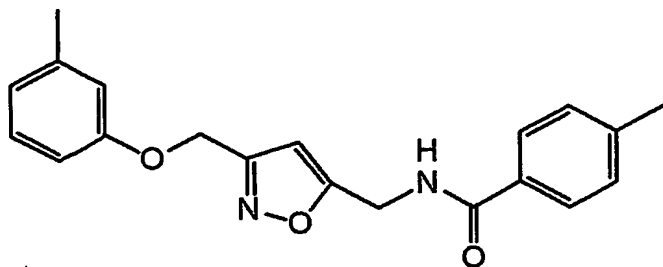
融点：86～90℃；

NMR： δ 2.25(3H, s), 3.75(3H, s), 4.62(2H, s), 5.00(2H, s), 6.27(1H, s), 6.60-7.83(9H, m)。

【0263】

実施例17(103)：N-{[3-(3-メチルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-49)：

【化149】



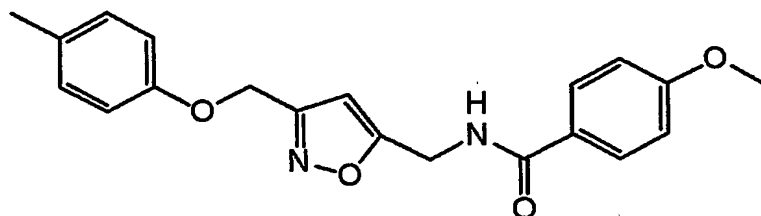
融点：94～96℃；

NMR： δ 2.31(3H, s), 2.35(3H, s), 4.72(2H, d), 5.05(2H, s), 6.33(1H, s), 6.61-7.76(9H, m)。

【0264】

実施例17(104)：N-{[3-(4-メチルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-50)：

【化150】



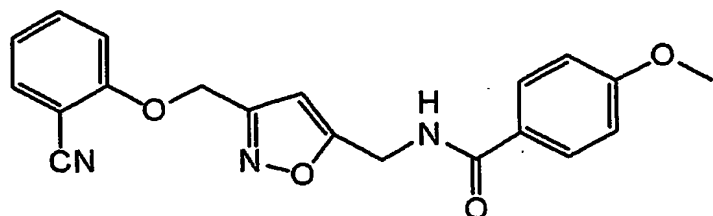
融点：124～127℃；

NMR： δ 2.27(3H, s), 3.80(3H, s), 4.68(2H, s), 5.03(2H, s), 6.33(1H, s), 6.64-8.00(9H, m)。

【0265】

実施例17(105)：N-{[3-(2-シアノフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-51)：

【化151】

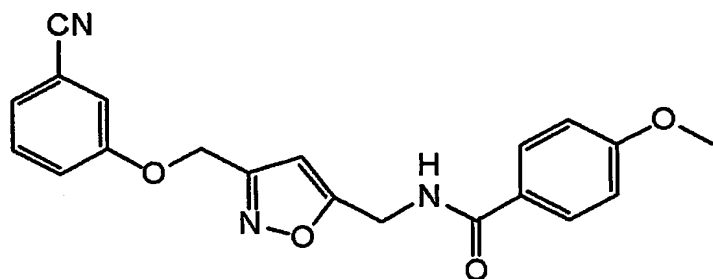


融点：111～114℃。

【0266】

実施例17(106)：N-{[3-(3-シアノフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-52)：

【化152】

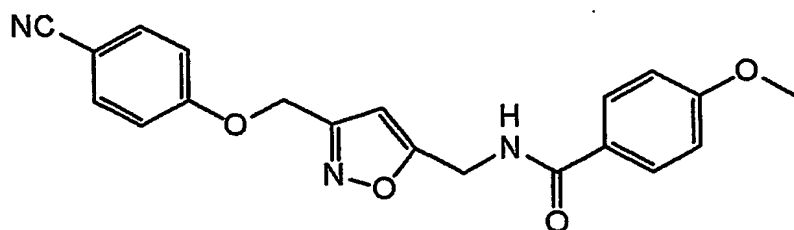


融点：128～130℃。

【0267】

実施例17(107)：N-{[3-(4-シアノフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-53)：

【化153】



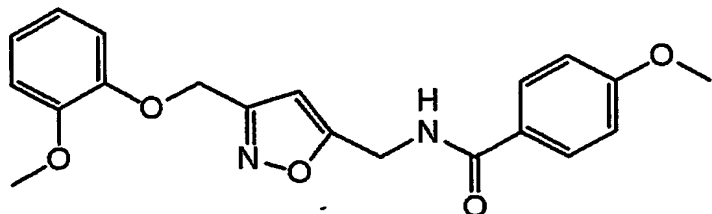
融点：119～121℃；

NMR： δ 3.81(3H, s), 4.72(2H, d), 5.14(2H, s), 6.32(1H, s), 6.73-8.02(9H, m)。

【0268】

実施例17(108) : N- { [3-(2-メトキシフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-54) :

【化154】



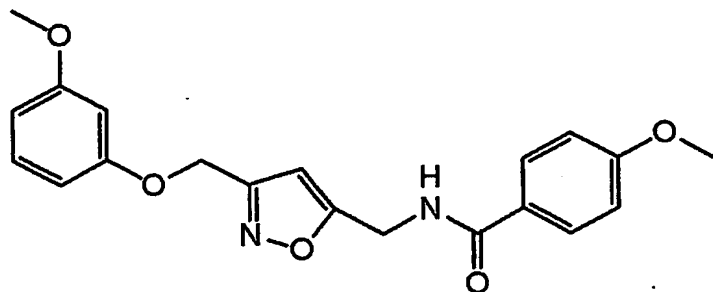
性状 : 油状,

NMR : δ 3.75(6H, s), 4.60(2H, d), 5.07(2H, s), 6.28(1H, s), 6.69-7.90(9H, m)。

【0269】

実施例17(109) : N- { [3-(3-メトキシフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-55) :

【化155】

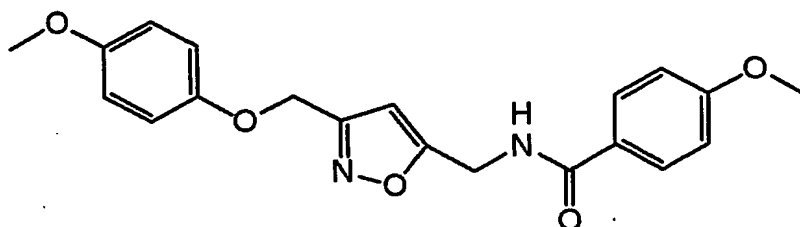


融点 : 95 ~ 104℃。

【0270】

実施例17(110) : N- { [3-(4-メトキシフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-56) :

【化156】

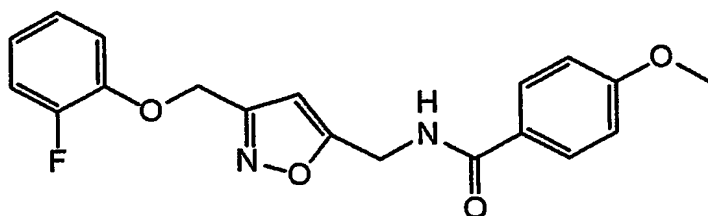


融点：115～121℃。

【0271】

実施例17(111)：N-{[3-(2-フルオロフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-57）：

【化157】

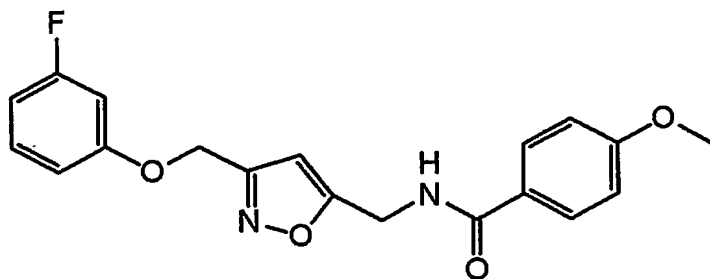


融点：97～102℃。

【0272】

実施例17(112)：N-{[3-(3-フルオロフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-58）：

【化158】



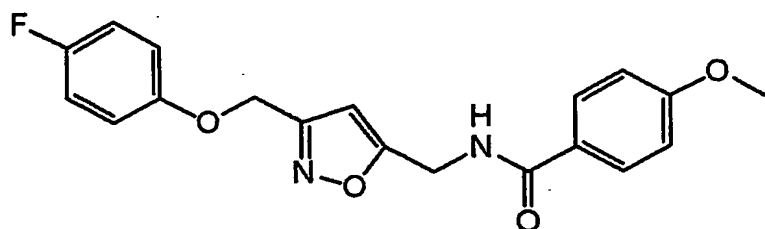
融点：95～106℃。

【0273】

実施例17(113)：N-{[3-(4-フルオロフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-59）：

5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-59) :

【化159】

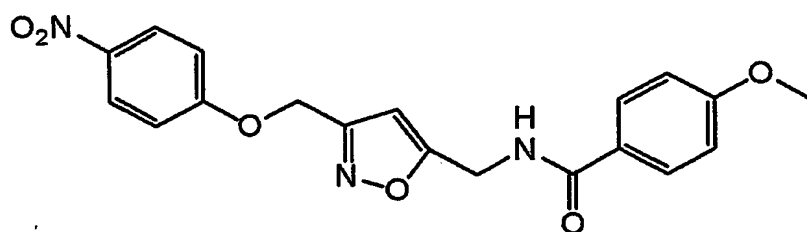


融点: 95~106℃。

【0274】

実施例17(114): N-{[3-(4-ニトロフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-60) :

【化160】

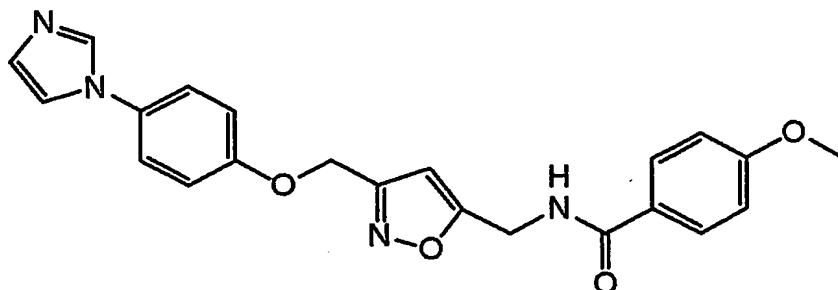


融点: 151~154℃。

【0275】

実施例17(115): N-{[3-(イミダゾール-2-イルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号IV-72) :

【化161】



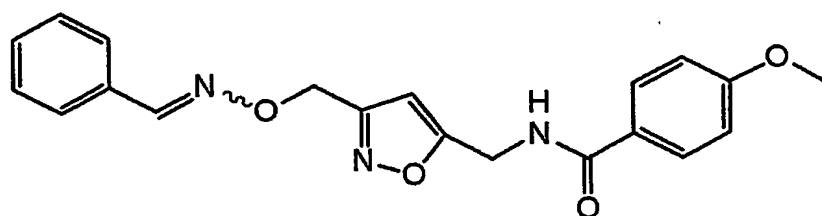
融点: 138~142℃,

NMR : δ 3.80(3H, s), 4.70(2H, d), 5.08(2H, s), 6.32(1H, s), 6.78-7.93 (12H, m)。

【0276】

実施例 17 (116) : {3-[(4-メトキシフェニル)カルボニルアミノメチル]-5-イソオキサゾリル}メトキシイミノベンジルの製造 (化合物番号 IV-74) :

【化 162】



性状 : アモルファス,

NMR : δ 3.76(3H, s), 4.65(2H, d), 5.18(2H, s), 5.32(1H, s), 6.25(1H, s), 6.73-8.09(11H, m)。

【0277】

製剤例 1

I-25の化合物 16質量部、ペンナイト 28質量部、タルク 52質量部、ドデシルベンゼンスルホン酸ソーダ 2質量部及びリグニンスルホン酸ソーダ 2質量部を混合、粉碎し、水約 20質量部を加えて、混練機で練った後、造粒機を通して造粒し、次いで乾燥整粒して粒剤を得た。

【0278】

製剤例 2

II-3の化合物 20質量部、珪藻土 30質量部、クレー 36質量部、ホワイトカーボン 5質量部、リグニンスルホン酸ソーダ 4質量部及びアルキルナフタレンスルホン酸ソーダ 5質量部を混合粉碎して水和剤を得た。

【0279】

製剤例 3

III-12の化合物 20質量部、カオリンクレー 65質量部及びタルク 15質量部をよく混合、粉碎して 20%粉剤を得た。

【 0 2 8 0 】

製剤例 4

IV-8 の化合物 1 2 . 5 質量部、エチレングリコール 4 質量部、ソルポール 3 9 4 0 (商品名：東邦化学製) 5 質量部、ルノックス 1 0 0 0 C (商品名：東邦化学製) 1 質量部、水 7 7 質量部をよく混合し、平均粒径 5 μ m 以下になるまで湿式粉碎した後、キサンタンガム 0 . 5 質量部を混合し、フロアブル剤を得た。

【 0 2 8 1 】

製剤例 5

I-28 の化合物 2 0 質量部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 1 4 質量部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 1 0 質量部及びキシレン 5 6 質量部を混合して乳剤を得た。

【 0 2 8 2 】

製剤例 6

II-100 の化合物 1 7 質量部、塩化カリウム 7 9 . 5 質量部、ニューカルゲン FS-1 (商品名：竹本油脂株式会社製) を 2 質量部、デキストリン 1 質量部及びキサンタンガム 0 . 5 質量部を混和し、水 2 0 質量部を加えて、混練機で練った後、造粒機を通して造粒し、次いで乾燥整粒して粒剤を得、これを水溶性フィルムで作製した袋状の容器に充填し、充填口をヒートシールにより閉じジャンボ剤を得た。

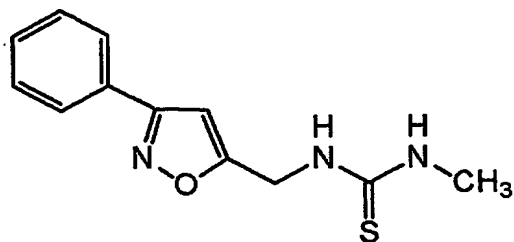
【 0 2 8 3 】

【試験例】

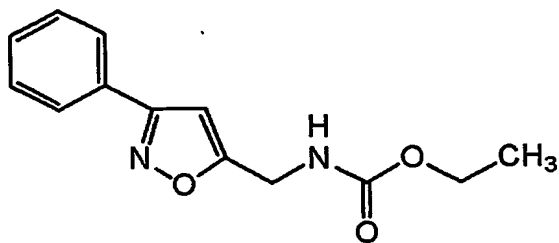
次に本発明化合物の農園芸用殺菌剤としての試験例を記載する。

なお、比較薬剤として特開昭 5 2 - 1 5 4 5 2 5 号公報に記載の下記化合物 A 及び B を用いた。

【化 1 6 3】



化合物 A



化合物 B

【0 2 8 4】

試験例 1 イネいもち病に対する効果試験

製剤例 2 に準じて調製した本発明化合物製剤を、水で希釈して 2 0 0 p p m に調製したのち、直径 6 c m のプラスチック製の鉢にて育成した 3 葉期のイネ（品種：コシヒカリ、1 5 本植え）にスプレーガンにて十分量散布した。翌日イネいもち病菌（*Pyricularia oryzae*）孢子懸濁液を噴霧接種した。ポットを 2 2℃ 温室下に 2 4 時間保持した後、温室内に 7 日間放置し、第 3 葉の病斑数を肉眼調査し、表 2 8 に示す基準により評価した。その結果を表 2 9 に示す。

【0 2 8 5】

【表 2 8】

評価	病斑面積歩合 (%)
5	0
4	1 ~ 5
3	6 ~ 1 0
2	1 1 ~ 2 0
1	2 1 ~ 4 1
0	4 1 以上

【0286】

【表29】

表28：イネいもち病に対する効果

化合物No.	評価	化合物No.	評価	化合物No.	評価
I-4	5	III-13	5	III-180	5
I-6	5	III-14	5	III-201	5
I-25	5	III-17	5	III-208	4
I-26	5	III-18	5	III-210	5
I-27	5	III-19	5	IV-1	5
I-28	4	III-26	5	IV-2	5
I-29	5	III-27	5	IV-3	5
I-30	5	III-28	5	IV-4	4
I-31	4	III-31	5	IV-5	4
I-32	5	III-34	5	IV-6	5
I-33	5	III-37	5	IV-8	3
I-38	5	III-40	5	IV-9	5
I-41	3	III-43	5	IV-10	5
I-45	4	III-49	5	IV-11	5
I-47	4	III-51	5	IV-12	5
I-48	4	III-52	5	IV-29	3
I-49	3	III-61	5	IV-33	5
II-2	5	III-67	5	IV-34	5
II-3	3	III-73	5	IV-35	5
II-7	5	III-74	5	IV-45	5
II-9	5	III-107	5	IV-46	5
II-12	4	III-108	2	IV-47	5
II-13	5	III-109	4	IV-48	5
II-14	4	III-111	5	IV-49	5
II-15	3	III-121	5	IV-50	5
II-48	3	III-122	4	IV-51	4
II-49	4	III-123	5	IV-52	4
II-50	5	III-124	5	IV-53	5
II-99	3	III-130	4	IV-54	5
II-100	4	III-133	4	IV-55	5
III-2	4	III-134	3	IV-56	5
III-4	3	III-137	4	IV-57	5
III-5	4	III-139	5	IV-58	5
III-6	5	III-156	4	IV-59	5
III-10	5	III-162	5	化合物A	0
III-11	5	III-174	4	化合物B	0
III-12	5	III-177	4		

【 0 2 8 7 】

試験例 2 キュウリ炭疽病に対する効果試験

製剤例 2 に準じて調製した本発明化合物製剤を、水で希釈して 2 0 0 p p m に調製したのち、直径 6 c m のプラスチックポットにて育成した 3 葉期のキュウリ（品種：ときわ光 3 号 P 型）の第 1 葉と第 2 葉にスプレーガンにて十分量散布した。翌日キュウリ炭疽病菌（*Colletotrichum lagenarium*）孢子懸濁液を噴霧接種した。ポットを 2 2 ℃ 温室下に 2 4 時間保持した後、温室内に 7 日間放置し、第 1 葉と第 2 葉の病斑面積率を肉眼調査し、表 3 0 に示す基準により評価した。その結果を表 3 1 に示す。

【 0 2 8 8 】

【表 3 0】

評価	病斑面積歩合 (%)
5	0
4	1 ~ 5
3	6 ~ 1 0
2	1 1 ~ 2 0
1	2 1 ~ 4 1
0	4 1 以上

【0289】

【表31】

表31：キュウリ炭疽病菌に対する効果

化合物No.	評価	化合物No.	評価	化合物No.	評価
I-4	5	III-27	5	III-208	4
I-6	5	III-28	4	III-210	5
I-26	5	III-31	5	IV-1	5
I-27	5	III-34	5	IV-2	5
I-28	5	III-37	3	IV-3	5
I-29	5	III-40	5	IV-4	4
I-30	5	III-43	4	IV-9	5
I-33	5	III-49	5	IV-10	5
I-38	5	III-51	4	IV-11	5
I-41	4	III-52	5	IV-12	5
I-45	4	III-61	4	IV-29	3
I-47	4	III-67	5	IV-33	5
II-7	5	III-73	4	IV-34	5
II-9	5	III-74	5	IV-35	5
II-12	4	III-107	5	IV-45	5
II-13	5	III-108	3	IV-46	5
II-14	5	III-109	5	IV-47	5
II-15	4	III-111	5	IV-48	4
II-48	4	III-121	5	IV-49	5
II-100	4	III-122	4	IV-50	5
III-2	4	III-123	5	IV-51	4
III-4	4	III-124	4	IV-52	4
III-5	4	III-130	4	IV-53	5
III-6	4	III-133	4	IV-54	5
III-10	5	III-134	5	IV-55	5
III-11	3	III-137	5	IV-56	5
III-12	5	III-139	5	IV-57	4
III-13	5	III-156	4	IV-58	5
III-14	3	III-162	5	IV-59	5
III-17	5	III-174	4	化合物A	0
III-18	5	III-177	4	化合物B	0
III-19	4	III-180	5		
III-26	5	III-201	5		

【0290】

【発明の効果】

一般式 (I) または (IA) で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体は、低薬量で植物病害、特にイネいもち病、キュウリ炭疽病に対して防除の

効果を示すが、作物に対しては安全であり農園芸用の殺菌剤として有用である。

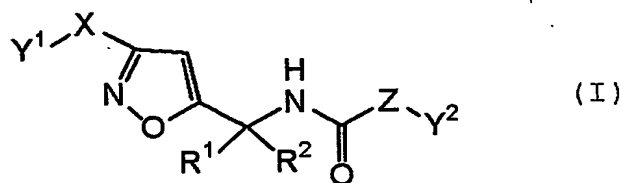
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 既知の薬剤耐性菌に交差することなく、かつ十分な植物病害防除活性を発揮する新規な薬剤を提供する。

【解決手段】 一般式（I）で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体およびこの誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【化 1】



〔式中、 R^1 及び R^2 は水素原子、（置換）アルキル等；Xは単結合、アルキレン等； Y^1 は（置換）低級アルキル、（置換）シクロアルキル、（置換）フェニル、（置換）ヘテロアリール等、 Y^2 は（置換）シクロアルキル、（置換）フェニル、（置換）ヘテロアリール等；Zは（置換）アルキレン、 $-O-$ （（置換）アルキレン） $-$ 、 $-NR-$ （（置換）アルキレン） $-$ 等〕

【選択図】 なし

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000127879]

1. 変更年月日 1998年10月20日

[変更理由] 住所変更

住 所 東京都港区芝2丁目5番6号

氏 名 株式会社エス・ディー・エス バイオテック

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.